WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM

Internationales Buro INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 405/04, A01N 43/68, C07D 251/18

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 97/00254

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

3. Januar 1997 (03.01.97)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP96/02479

A1

(22) Internationales Anmeldedatum:

7. Juni 1996 (07.06.96)

(30) Prioritätsdaten:

195 22 137.0

19. Juni 1995 (19.06.95)

DE

HOECHST SCHERING AGREVO GMBH (71) Anmelder: [DE/DE]; Miraustrasse 54, D-13509 Berlin (DE).

(72) Erfinder: LORENZ, Klaus; Am Helgengraben 18, D-64331 Weiterstadt (DE). MINN, Klemens; Rossertstrasse 61, D-65795 Hattersheim (DE). WILLMS, Lothar, Königsteiner Strasse 50, D-65719 Hofheim (DE). BAUER, Klaus; Doorner Strasse 53D, D-63456 Hanau (DE). BIERINGER, Hermann; Eichenweg 26, D-65817 Eppstein (DE). ROSINGER, Christopher; Am Hochfeld 33, D-65719 Hofheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AL, AM, AU, AZ, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, GE, HU, IL, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UZ, VN, ARIPO Patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: 2-AMINO-1,3,5-TRIAZINES, PROCESS FOR THEIR PREPARATION AND THEIR USE AS HERBICIDES AND PLANT-GROWTH REGULATORS

(54) Bezeichnung: 2-AMINO-1,3,5-TRIAZINE, VERFAHREN ZU DEREN HERSTELLUNG UND DEREN VERWENDUNG ALS HERBIZIDE UND PFLANZENWACHSTUMSREGULATOREN

(57) Abstract

The invention concerns compounds of formula (I) and their salts, in which formula R¹ to R⁹, X, Y, n and m are defined as in claim 1. which are suitable as herbicides and plant-growth regulators. They can be prepared by processes as defined in claim 6 by means of intermediate products of formula (IV), some f which are novel.

(57) Zusammenfassung

Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin R1 bis R9, X, Y n und m wie in Anspruch 1 definiert sind, eignen sich als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren. Ihre Herstellung kann nach Verfahren, wie sie in Anspruch 6

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & R^{7} R^{8} \\
R^{4}R^{5}N & N & N & R^{6}-CH-CH-Y
\end{array}$$
(R)

$$\begin{array}{c}
R^{1} \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N \\
R^{4}R^{5}N & N \\
\end{array}$$
(IV)

definiert sind, über zum Teil neue Zwischenprodukte der Formel (IV) erfolgen.

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX -	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE NE	
ΔŪ	Australien	GN	Guinea	NL NL	Niger Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	
BE	Belgien	HU	Ungarn	NZ	Norwegen
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Neuseeland
BG	Bulgarien	Ē	Italien		Polen
BJ	Benin	JP	Japan	PT RO	Portugal
BR	Brasilien	KE	Kenya		Rumânien
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	RU	Russische Föderation
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SD	Sudan
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SE	Schweden
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SG	Singapur
CH	Schweiz	u	Liechtenstein	SI	Slowenien
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SK	Slowakei
CM	Kamerun	LR	Liberia	SN	Senegal
CN	China	LK	Litauen	SZ	Swasiland
cs	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TD	Tschad
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TG	Togo
DE	Deutschland	MC	Monaco	TJ	Tadschikistan
DK	Dänemark	MD		TT	Trinidad und Tobago
EE	Estland	MG	Republik Moldau	UA	Ukraine
ES	Spanica	ML	Madagaskar Mali	UG	Uganda
FI	Finnland	MN		US	Vereinigte Staaten von Amerika
FR	Frankreich	MR	Mongolei	UZ	Usbekistan
GA	Gabon	MW	Mauretanies	VN	Vietnam
		147 44	Malawi		

2-Amino-1,3,5-triazine, Verfahren zu deren Herstellung und deren Verwendung als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren

Die Erfindung betrifft das technische Gebiet der Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren, insbesondere der Herbizide zur selektiven Bekämpfung von Unkräutern und Ungräsern in Nutzpflanzenkulturen.

Es ist bekannt, daß 2-Amino-4-alkylamino-6-a-halogenalkyl-1,3,5-triazine herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Eigenschaften besitzen (WO 90/09378 (EP-A-411153), WO 88/02368 (EP-A-283522), WO 94/24086, EP-A-509544, EP-A-492,615). Die Anwendung vieler der bekannten Derivate dieses Typs als selektive Herbizide zur Schadpflanzenbekämpfung oder als Pflanzenwachstumsregulatoren in verschiedenen Nutzpflanzenkulturen führt jedoch häufig zu unerwünschten Schädigungen der Nutzpflanzen. Überraschenderweise wurden nun neue 2-Amino-1,3,5-triazine gefunden, die vorteilhaft als Herbizide und Pflanzenwachstumsregulatoren eingesetzt werden können. Beispielsweise werden beim Einsatz der erfindungsgemäßen Verbindungen die Kulturpflanzen nicht oder in geringerem Umfang geschädigt als bei den bekannten Wirkstoffen ähnlichen Typs.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind Verbindungen der Formel (I) und deren Salze.

worin

- R¹ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z¹-R¹⁰,
- ${\sf R^2}$ und ${\sf R^3}$ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel - ${\sf Z^2}$ - ${\sf R^{11}}$ oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen carbocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern oder einen heterocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten zwei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 6 C-Atomen, oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest oder
 - R⁴ und R⁵ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR⁴R⁵ einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 4 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom die gegebenenfalls weiteren Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S ausgewählt sind und der Rest unsubstituiert oder substituiert ist,
- R6 Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen
 Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis
 10 C-Atomen, vorzugsweis mit 1 bis 6 C-Atomen, oder einen
 Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit
 jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe

- N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest,
- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 6 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- R⁹ jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, (C2-C6)Alkenyloxy, (C2-C6)Alkinyloxy, (C1-C4)Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkyloxycarbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-thiocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylthiocarbonyl oder (C1-C4)Alkylthio-thiocarbonyl, wobei die Alkylreste in den letztgenannten 11 Resten unsubstituiert oder substituiert sind, oder (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Halogenalkylsulfonyl, (C_1-C_4) Alkoxysulfonyl, Amino, Mono- oder Di-[(C1-C6)alkyl]amino, Aminocarbonyl, Mono- oder $Di-\{(C_1-C_6)alkyl\}aminocarbonyl, (C_1-C_6)Alkanoylamino, N-(C_1-C_6)Alkanoylamino, N-(C_1-C_6$ N-(C₁-C₄)alkyl-amino oder einen Rest der Formel Z⁴-R⁰, wobei Z⁴ wie unten definiert und Ro einen aromatischen, gesättigten oder teilgesättigten carbocyclischen oder heterocyclischen Rest bedeutet, wobei der cyclische Rest substituiert oder unsubstituiert ist, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest beispielsweise jeweils mit 1 bis 20 C-Atomen, vorzugsweise mit 1 bis 10, oder einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest, vorzugsweise mit 3 bis 8 C-Atomen, insbesondere 3 bis 6 C-Atomen, oder einen heterocyclischen Rest, vorzugsweise mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wob i jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR $^{\circ}$ oder -N(O)-, wobei q=0,1 oder 2 ist und R $^{\circ}$ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S(O)_r-, -NR**- oder -N(O)-, wobei r=0, 1 oder 2 ist und R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder ein divalente Gruppe der Formel

 -O-, -S(O)_p-, -S(O)_p-O-, -O-S(O)_p-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -O-NR'-, -NR'-O-, -NR'-CO-, -CO-NR'- bedeutet und dabei p = 0, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,
- m 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 1 oder 2, und
- n 0, 1, 2, 3, 4 oder 5, vorzugsweise 0, 1, 2, 3 oder 4, insbesondere 2 oder 3,

bedeuten.

Die Verbindungen der Formel (I) können durch Anlagerung einer geeigneten anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise HCI, HBr, H₂SO₄ oder HNO₃, aber auch Oxalsäure oder Sulfonsäuren an eine basiche Gruppe, wie z.B. Amino oder Alkylamino, Salze bilden. Geeignete Substituenten, die in deprotonierter Form, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, vorliegen können, können innere Salze mit ihrerseits protonierbaren Gruppen, wie Aminogruppen bilden. Salze können ebenfalls dadurch gebildet werden, daß bei geeigneten Substituenten, wie z.B. Sulfonsäuren oder Carbonsäuren, der Wasserstoff durch ein für die Landwirtschaft geeignetes Kation ersetzt wird. Diese Salze sind beispielsweise Metallsalze, insbesondere Alkalimetallsalze oder Erdalkalimetallsalze, insbesondere Natrium- und Kaliumsalze, oder auch Ammoniumsalze oder Salze mit organischen Aminen.

In Formel (I) und allen nachfolgenden Formeln können die Reste Alkyl, Alkoxy, Haloalkyl, Haloalkoxy, Alkylamino und Alkylthio sowie die entsprechenden ungesättigten und/oder substituierten Reste im Kohlenstoffgerüst jeweils geradkettig oder verzweigt sein. Wenn nicht speziell angegeben, sind bei diesen Resten die niederen Kohlenstoffgerüste, z.B. mit 1 bis 6 C-Atomen bzw. bei ungesättigten Gruppen mit 2 bis 6 C-Atomen, bevorzugt. Alkylreste, auch in den zusammengesetzten Bedeutungen wie Alkoxy, Haloalkyl usw., bedeuten z.B. Methyl, Ethyl, n- oder i-Propyl, n-, i-, t- oder 2-Butyl, Pentyle, Hexyle, wie n-Hexyl, i-Hexyl und 1,3-Dimethylbutyl, Heptyle, wie n-Heptyl, 1-Methylhexyl und 1,4-Dimethylpentyl; Alkenyl- und Alkinylreste haben die Bedeutung der den Alkylresten entsprechenden möglichen ungesättigten Reste; Alkenyl bedeutet z.B. Allyl, 1-Methylprop-2-en-1-yl, 2-Methyl-prop-2-en-1-yl, But-2-en-1-yl, But-3-en-1-yl, 1-Methyl-but-3-en-1-yl, But-3-in-1-yl, 1-Methyl-but-3-in-1-yl.

Cycloalkyl bedeutet ein carbocyclisches, gesättigtes Ringsystem mit vorzugsweise 3-8 C-Atomen, z.B. Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.

Halogen bedeutet beispielsweise Fluor, Chlor, Brom oder Iod. Haloalkyl, -alkenyl und -alkinyl bedeuten durch Halogen, vorzugsweise durch Fluor, Chlor und/oder Brom, insbesondere durch Fluor oder Chlor, teilweise oder vollständig substituiertes Alkyl, Alkenyl bzw. Alkinyl, z.B. Monohaloalkyl (= Monohalogenalkyl), Perhaloalkyl, CF₃, CHF₂, CH₂F, CF₃CF₂, CH₂FCHCl, CCl₃, CHCl₂, CH₂Cl; Haloalkoxy ist z.B. OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ und OCH₂CH₂Cl; entsprechendes gilt für Haloalkenyl und andere durch Halogen substituierte Reste.

Ein Kohlenwasserstoffrest ist ein geradkettiger, verzweigter oder cyclischer und gesättigter oder ungesättigter aliphatischer oder aromatischer Kohlenwasserstoffrest, z.B. Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl oder Aryl; Aryl bedeutet dabei ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, beispielsweise Phenyl, Naphthyl, Tetrahydronaphthyl, Indenyl, Indanyl,

Pentalenyl, Fluorenyl und ähnliches, vorzugsweise Phenyl; vorzugsweise bedeutet ein Kohlenwasserstoffrest Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl mit bis zu 12 C-Atomen oder Cycloalkyl mit 3, 4, 5, 6 oder 7 Ringatomen oder Phenyl; entsprechendes gilt für einen Kohlenwasserstoffrest in einem Kohlenwasserstoffoxyrest.

Ein heterocyclischer Rest oder Ring (Heterocyclyl) kann gesättigt, ungesättigt oder heteroaromatisch sein; er enthält vorzugsweise eine oder mehrere Heteroeinheiten im Ring, d.h. Heteroatome oder Ringglieder, welche auch substituierte Heteroatome einschließen, vorzugsweise aus der Gruppe N, O, S, SO, SO₂; vorzugsweise ist er ein aliphatischer Heterocyclylrest mit 3 bis 7 Ringatomen oder ein heteroaromatischer Rest mit 5 oder 6 Ringatomen und enthält 1, 2 oder 3 Heteroeinheiten. Der heterocyclische Rest kann z.B. ein heteroaromatischer Rest oder Ring (Heteroaryl) sein, wie z.B. ein mono-, bi- oder polycyclisches aromatisches System, in dem mindestens 1 Ring ein oder mehrere Heteroatome enthält, beispielsweise Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazinyl, Pyrazinyl, Thienyl, Thiazolyl, Oxazolyl, Furyl, Pyrrolyl, Pyrazolyl und Imidazolyl, oder ist ein partiell oder vollständig hydrierter Rest wie Oxiranyl, Pyrrolidyl, Piperidyl, Piperazinyl, Dioxolanyl, Morpholinyl, Tetrahydrofuryl. Als Substituenten für einen substituierten heterocyclischen Rest kommen die weiter unten genannten Substituenten in Frage, zusätzlich auch Oxo. Die Oxogruppe kann auch an den Heteroringatomen, die in verschiedenen Oxidationsstufen existieren können, z.B. bei N und S, auftreten.

Substituierte Reste, wie substituierte Kohlenwasserstoffreste, z.B. substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Aryl, Phenyl und Benzyl, oder substituiertes Heterocyclyl oder Heteroaryl, bedeuten beispielsweise einen vom unsubstituierten Grundkörper abgeleiteten substituierten Rest, wobei die Substituenten beispielsweise einen oder mehrere, vorzugsweise 1, 2 oder 3 Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Haloalkoxy, Alkylthio, Hydroxy, Amino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Dialkylaminocarbonyl, substituiertes Amino, wie Acylamino, Mono- und Dialkylamino, und Alkylsulfinyl, Haloalkylsulfinyl, Alkylsulfonyl,

WO 97/00254 PCT/EP96/02479

7

Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch Alkyl und Haloalkyl bedeuten; im Begriff "substituierte Reste" wie substituiertes Alkyl etc. sind als Substituenten zusätzlich zu den genannten gesättigten kohlenwasserstoffhaltigen Resten entsprechende ungesättigte aliphatische und aromatische Reste, wie gegebenenfalls substituiertes Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Phenyl, Phenoxy etc. eingeschlossen. Bei Resten mit C-Atomen sind solche mit 1 bis 4 C-Atomen, insbesondere 1 oder 2 C-Atomen, bevorzugt. Bevorzugt sind in der Regel Substituenten aus der Gruppe Halogen, z.B. Fluor und Chlor, (C₁-C₄)Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, (C₁-C₄)Haloalkyl, vorzugsweise Trifluormethyl, (C₁-C₄)Alkoxy, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, Nitro und Cyano. Besonders bevorzugt sind dabei die Substituenten Methyl, Methoxy und Chlor.

Mono- oder disubstituiertes Amino bedeutet einen chemisch stabilen Rest aus der Gruppe der substituierten Aminoreste, welche beispielsweise durch einen bzw. zwei gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Alkyl, Alkoxy, Acyl und Aryl N-substituiert sind; vorzugsweise Monoalkylamino, Dialkylamino, Acylamino, Arylamino, N-Alkyl-N-arylamino sowie N-Heterocyclen; dabei sind Alkylreste mit 1 bis 4 C-Atomen bevorzugt; Aryl ist dabei vorzugsweise Phenyl oder substituiertes Phenyl; für Acyl gilt dabei die weiter unten genannte Definition, vorzugsweise (C₁-C₄)Alkanoyl. Entsprechenes gilt für substituiertes Hydroxylamino oder Hydrazino.

Gegebenenfalls substituiertes Phenyl ist vorzugsweise Phenyl, das unsubstituiert oder ein- oder mehrfach, vorzugsweise bis zu dreifach durch gleiche oder verschiedene Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Halogenalkyl, (C_1-C_4) Halogenalkoxy und Nitro substituiert ist, z.B. o-, mund p-Tolyl, Dimethylphenyle, 2-, 3- und 4-Chlorphenyl, 2-, 3- und 4-Trifluorund -Trichlorphenyl, 2,4-, 3,5-, 2,5- und 2,3-Dichlorphenyl, o-, m- und p-Methoxyphenyl.

Ein Acylrest bedeutet den Rest einer organischen Säure, z.B. den Rest einer Carbonsäure und Reste davon abgeleiteter Säuren wie der Thiocarbonsäure, gegebenenfalls N-substituierten Iminocarbonsäuren oder den Rest von Kohlensäuremonoestern, gegebenenfalls N-substituierter Carbaminsäure, Sulfonsäuren, Sulfinsäuren, Phosphonsäuren, Phosphinsäuren. Acyl bedeutet beispielsweise Formyl, Alkylcarbonyl wie [(C₁-C₄)Alkyl]-carbonyl, Phenylcarbonyl, Alkyloxycarbonyl, Phenyloxycarbonyl, Benzyloxycarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfinyl, N-Alkyl-1-iminoalkyl und andere Reste von organischen Säuren. Dabei können die Reste jeweils im Alkyl- oder Phenylteil noch weiter substituiert sein, beispielsweise im Alkylteil durch ein oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Alkoxy, Phenyl und Phenoxy; Beispiele für Substituenten im Phenylteil sind die bereits weiter oben allgemein für substituiertes Phenyl erwähnten Substituenten.

Gegenstand der Erfindung sind auch alle Stereoisomeren, die von Formel (I) umfaßt sind, und deren Gemische. Solche Verbindungen der Formel (I) enthalten ein oder mehrere asymmetrische C-Atome oder auch Doppelbindungen, die in den allgemeinen Formeln (I) nicht gesondert angegeben sind. Die durch ihre spezifische Raumform definierten möglichen Stereoisomeren, wie Enantiomere, Diastereomere, Z- und E-Isomere sind alle von der Formel (I) umfaßt und können nach üblichen Methoden aus Gemischen der Stereoisomeren erhalten oder auch durch stereoselektive Reaktionen in Kombination mit dem Einsatz von stereochemisch reinen Ausgangsstoffen hergestellt werden.

Vor allem aus den Gründen der höheren herbiziden Wirkung, besseren Selektivität und/oder besseren Herstellbarkeit sind erfindungsgemäße Verbindungen der genannten Formel (I) oder deren Salze von besonderem Interesse, worin

R¹ H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder -Z¹-R¹⁰,

 R^2 und R^3 jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO $_2$, CN, SCN oder einen Rest der Formel - Z^2 - $R^{1\,1}$ oder R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3

 (C_3-C_8) Cycloalkyl, (C_3-C_8) Cycloalkenyl oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino R⁴ und R⁵ oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C2-C4)Alkenyloxy, (C2-C4)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)Alkoxy]$ -carbonyl, $[(C_1-C_4)Alkyl]$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)alkyl]$ -aminocarbonyl, $(C_1-C_4)Alkylsulfinyl$, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch $(C_1-C_4)Alkyl$ und $(C_1-C_4)Haloalkyl$ substituiert ist,

oder einen Acylrest oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

R6 Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen im Alkylrest, inen acyclischen oder cyclischen
Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder

Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)$ Alkoxy]-carbonyl, $[(C_1-C_4)$ Alkyl]-carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- $[(C_1-C_4)$ Alkyl]-aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch (C_1-C_4) Alkylund (C_1-C_4) Haloalkyl substituiert ist, oder einen Acylrest,

- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder
 R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkyloxycarbonyl oder (C₁-C₄)Alkylthiocarbonyl, wobei die letztgenannten fünf Reste unsubstituiert oder durch Halogen oder (C₁-C₄)Alkoxy substituiert sind, oder (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)Alkyl]amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkanoylamino oder einen Rest der Formel Z⁴-R^o, worin Z⁴ wie unten definiert ist und R^o (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₃-C₆)Cycloalkenyl oder Phenyl bedeutet, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, oder

zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Rest aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 1 bis 6 C-Atomen, einen cyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 6 C-Atomen oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 9 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $\{(C_1-C_4)Alkoxy\}$ -carbonyl, $\{(C_1-C_4)Alkyl\}$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di-[(C1-C4)alkyl]-aminocarbonyl, $(C_1-C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4)Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4)Alkylsulfonyl,$ (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist, vorzugsweise R¹⁰, R¹¹, R¹² Wasserstoff, (C₁-C₈)Alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C2-C6)Alkinyl, (C3-C9)Cycloalkyl, (C3-C9)Cycloalkenyl, Phenyl, Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 7 Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Haloalkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, Amino, Mono- und Di[(C_1-C_4) alkyl]amino, (C_1-C_4) Alkanoylamino, Benzoylamino, Nitro, Cyano, [(C1-C4)Alkyl]carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di-[(C_1 - C_4)alkyl]aminocarbonyl, (C_1 - C_4)Alkylsulfonyl und, im Fall cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist,
- eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR * oder -N(O)-, wobei q=0,1 oder 2 ist und R * Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -0-, -S(O)_r-, -NR ** oder -N(O)-, wobei r = 0, 1 oder 2 ist und R ** Wasserstoff oder Alkyl mit 1

bis 4 C-Atomen ist, oder ein Grupp der Formel - $\mathrm{CH_{2}}$ -, - $\mathrm{C(CH_{3})H}$ - oder - $\mathrm{C(CH_{3})_{2}}$ -,

Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel

-O-, -S-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei R' H oder (C_1 - C_4)Alkyl ist, vorzugsweise Z¹, Z², Z³, Z⁴ eine direkte Bindung oder Sauerstoff

bedeuten.

Von besonderem Interesse sind weiterhin erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin

R¹, R², R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C1-C4)Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di-[(C_1 - C_4)alkyl]-amino, Halo-(C_1 - C_4)alkyl, Hydroxy-(C_1 - C_4)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, (C_1-C_4) Alkylthio, Halo- (C_1-C_4) alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, $\label{eq:Halo-(C2-C6)Alkinyl, Halo-(C2-C6)alkinyl, Halo-(C2-C6)alkinyl, Halo-(C3-C6)alkinyl, Halo-(C3-C6)alkiny$ (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl, amino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkylamino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$ -carbonyl- $(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino$ -carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C1-C4)Alkyl,

 (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

- R² und R³ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR²R³ einen gesättigten oder teilweise ungesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe O, N und S, wobei jeder der letztgenannten 2 cyclischen Reste unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist,
- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo-(C₂-C₆)alkenyl, Halo-(C₂-C₆)alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Halo-(C₂-C₆)alkinyl, (C₁-C₄)Alkylamino-(C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy,

Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkylamino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, (C_3-C_9) Heterocyclyl- (C_1-C_4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C_1-C_4) Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalk xy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9

Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, Halo(C₁-C₄)alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C₁-C₄)alkyl, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

ist,

wenn n = 1 ist, und die Reste R⁹, jeweils unabhängig voneinander, wenn R⁹. n größer als 1 ist, Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₄)Alkyl, Cyano-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, Di- $[(C_1-C_4)alkyl]$ -amino, $\label{eq:condition} \begin{aligned} &\text{Halo-}(C_1-C_4)\text{alkyl, Hydroxy-}(C_1-C_4)\text{alkyl, } (C_1-C_4)\text{Alkoxy-}(C_1-C_4)\text{alkyl,} \end{aligned}$ $Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylthio, Halo-(C_1-C_4)alkylthio,$ (C_2-C_6) Alkenyl, Halo- (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $((C_1-C_4)$ alkyl)-amino- (C_1-C_4) alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkylamino-(C₁-C₄)alkyl, (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C1-C4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste, vorzugsweise bis zu drei Reste, aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C1-C4)Alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, $(C_1-C_4)Haloalkyl$, $(C_1-C_4)Haloalkoxy$, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder

mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkyl und Oxo substituiert

- eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-bedeuten.

Von besonderem Interesse sind auch erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, worin

- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- (C_1-C_4) alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu insgesamt drei, Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R² und R³ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylamino, Di-[(C₁-C₄)alkyl]-amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₂-C₆)Alkenyl, (C₂-C₆)Alkinyl, Phenyl oder Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere, vorzugsweise bis zu insgesamt drei, Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy und (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder R² und R³ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR²R³ einen gesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern, der unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist,
- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl oder

Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl oder Phenoxy-carbonyl oder einen der letztgenannten drei Reste, der im Phenylteil bis zu dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Dialkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylamino-carbonyl oder einen der letztgenannten fünf Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Di- (C_1-C_4) alkyl-amino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl oder einen der letztgenannten drei Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Perhalo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl,

Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxycarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylcarbonyl, (C_1-C_4) Alkyloxycarbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 13 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy und (C_1-C_4) Alkoxycarbonyl substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten 3 bis 6 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N und 0 aufweist, oder

zwei benachbarte Reste R^9 gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste (C_1-C_4) Alkyl substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Methyl ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Methyl ist, bedeuten.

Bevorzugte erfindungsgemäße Verbindungen der Formel (I) und deren Salze sind solche, worin

- R¹ Wasserstoff, Halogen oder (C₁-C₄)Alkyl,
- ${
 m R}^2$ und ${
 m R}^3$ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, (C $_1$ -C $_4$)Alkyl oder Phenyl oder
 - R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 gesättigtes (C_4-C_6) Cycloalkyl,
- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl oder (C₁-C₄)Alkyl oder R⁴ und R⁵ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR⁴R⁵ einen

heterocyclischen Rest mit 4 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist,

R⁶ Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl,

 R^7 und R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl oder R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen,

 R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, $(C_1-C_4)Alkyl$ oder $(C_1-C_4)Alkoxy$,

m 1 oder 2.

n 2 oder 3,

X eine Gruppe der Formel -O- oder -NH- oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,

Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NHbedeuten.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der allgemeinen Formel (I) oder deren Salze, dadurch gekennzeichnet, daß man

a) eine Verbindung der Formel (II),

$$R^{1} - C \frac{X}{R^{15}} (CR^{2}R^{3})_{m}$$
 (11)

worin R¹⁵ eine funktionelle Gruppe aus der Gruppe Carbonsäureester, Carbonsäureorthoester, Carbonsäurechlorid, Carbonsäureamid, Carbonsäureanhydrid und Trichlormethyl bedeutet, mit einem Biguanidid der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt oder

b) eine Verbindung der Formel (IV),

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} & \stackrel{X}{\subset} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N & N \\
R^{4}R^{5}N & N & R^{16}
\end{array}$$

worin R^{16} einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, z.B. Chlor, Trichlormethyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl und unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl- (C_1-C_4) alkylsulfonyl oder (C_1-C_4) Alkylphenylsulfonyl, bedeutet, mit einem geeigneten Amin der Formel (V) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt, oder

c) unter Reaktion (nucleophiler Substitution) einer austauschfähigen Gruppe am Triazin der Verbindung der genannten Formel (IV) oder der Formel (X),

$$R^{1} - C \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m}$$

$$R^{16} \longrightarrow N \qquad (X)$$

worin jeder der Reste R^{16} unabhängig voneinander einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe, z.B. Chlor, Trichlormethyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl und unsubstituiertes oder

d)

substituiertes Phenyl- (C_1-C_4) alkylsulfonyl, bedeutet, diese Verbindung mit einem geeigneten Aziridin der Formel (XI),

worin R⁷ und R⁸ wie in Formel (I) definiert sind, und nachfolgend mit einem geeigneten Nucleophil der Formel (XII)

$$H-Y \longrightarrow (X | I)$$

unter Ringöffnung des Azirididinrings und, falls ein Triazin der Formel (X) eingesetzt wurde, durch Reaktion der noch vorhandenen austauschfähigen Gruppe am Triazingrundgerüst mit einer Verbindung der Formel NHR⁴R⁵ (Ammoniak oder Amin) umsetzt oder eine Verbindung der Formel (XIII)

durch Epoxidierung oder Cyclopropanierung in entsprechende Verbindungen der Formel (I) umsetzt,

wobei in den Formeln (II), (III), (IV), (V), (X), (XI), (XII) und (XIII) die Reste \mathbb{R}^1 , \mathbb{R}^2 , \mathbb{R}^3 , \mathbb{R}^4 , \mathbb{R}^5 , \mathbb{R}^6 , \mathbb{R}^7 , \mathbb{R}^8 , \mathbb{R}^9 sowie X, Y, m und n wie in Formel (I) definiert sind, mit der Maßgabe, daß in Variante d) m=1 ist.

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel (II) und (III) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Tetrahydrofuran (THF), Dioxan, Acetonitril, Dimethylformamid (DMF), Methanol und Ethanol, bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C; falls Säureadditionssalze der Formel (III) verwendet werden, setzt man diese in der Regel mit Hilfe einer Base in situ frei. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei beispielsweise im Bereich von 0,1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (III) eingesetzt. Die Verbindung der Formel (II) kann im Verhältnis zur Verbindung der Formel (III) beispielsweise äquimolar oder mit bis zu 2 Moläquvälenten Überschuß eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren in der Literatur bekannt (vergleiche: Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky, C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol.3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5, S.290).

Die Umsetzung der Verbindungen der Formel (IV) und (V) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. THF, Dioxan, Acetonitril, DMF, Methanol und Ethanol, bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des jeweiligen Lösungsmittels oder Lösungsmittelgemisches, vorzugsweise bei 20 °C bis 60 °C, wobei die Verbindung (V), falls als Säureadditionssalz eingesetzt, gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt wird. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in der Regel im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (IV) eingesetzt, die Verbindung der Formel (IV) kann beispielsweise äquimolar zur Verbindung der Formel (V) oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die

entsprechenden Verfahren aus der Literatur bekannt (vgl. Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky, C.W. Rees, Pergamon Press, Oxford, New York, 1984, Vol.3; Part 2B; ISBN 0-08-030703-5, S. 482).

Die Edukte der Formeln (II), (III), (IV) und (V) sind entweder kommerziell erhältlich oder können nach oder analog literaturbekannten Verfahren hergestellt werden. Die Verbindungen können beispielsweise auch nach einem der nachfolgend beschriebenen Verfahren hergestellt werden.

Die Verbindungen der Formel (III) können beispielsweise durch Reaktion der Amine der Formel (V) oder deren Salze mit Cyanoguanidin in einem inerten Lösungsmittel wie beispielsweise Chlorbenzol oder Diethylenglykol oder Tetrahydrofuran oder gegebenenfalls Wasser analog H.M. Eisa, A.S. Tantawy, M.M. El-Kerdawy, Pharmazie 46 (1991), 182-184 hergestellt werden. Gegebenenfalls kann der Zusatz von anorganischen Salze wie Eisen(III)chlorid die Reaktion beschleunigen oder eine Erniedrigung der Reaktionstemperatur bewirken (Sanwa Chem KK, JP 62215556).

Die Amine der Formel (V) oder Salze hiervon können beispielsweise durch Reduktion der entsprechenden Oxime mit beispielsweise LiAIH₄ (Bristol Labor. Inc. US 2703324) oder Hydrierung mit Wasserstoff und Raney Nickel (Suter, Zuter, Justus Liebigs Ann. Chem. 576 (1952), S. 215 ff, oder auch durch reduktive Aminierung aus den entsprechenden Acetonderivaten (vergl. A. Waefelaer, et. al., Bull. Soc. Chim. Belg. 85 (1976), 421-425) hergestellt werden.

Die Verbindung der Formel (IV), oder eine direkte Vorstufe davon, läßt sich beispielweise wie folgt herstellen:

1. Durch Reaktion einer Verbindung der Formel (II) mit inem Amidino-thioharnstoff-Derivat der Formel (VI),

worin R^{17} (C_1 - C_4)-Alkyl oder Phenyl-(C_1 - C_4)-alkyl bedeutet und R^4 und R^5 wie in Formel (I) definiert sind, werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, in denen $R^{16} = -SR^{17}$ bedeutet.

 Durch Umsetzung eines cyclischen Amidins der Formel (VII) oder eines Säureadditionssalzes davon,

$$\begin{array}{c}
R^{1} \times \times \\
 \times C \longrightarrow (CR^{2}R^{3})_{m} \\
 \times NH
\end{array}$$
(VII)

worin R¹, R², R³, X und m wie in Formel (I) definiert sind, mit einem N-Cyanodithioiminocarbonat der Formel (VIII),

$$NC-N=C$$
 $S-R^{18}$
 $S-R^{18}$
(VIII)

worin R^{18} (C_1 - C_4)-Alkyl oder Phenyl-(C_1 - C_4)-alkyl bedeutet, werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, worin $R^{16} = -S - R^{18}$ bedeutet.

- Durch Umsetzung eines Alkali-dicyanamids mit einem cyclischen Carbonsäurederivat der genannten Formel (II) werden Verbindungen der Formel (IV) erhalten, worin R¹⁶ = NH₂ bedeutet,
- 4. Durch Umsetzung von Trichloracetonitril mit einem cyclischen Carbonsäurenitril der Formel (IX).

$$\begin{array}{c}
R^{1} \times X \\
NC \times C \times (CR^{2}R^{3})_{m}
\end{array} (IX)$$

worin R^1 , R^2 , R^3 , X und m wie in Formel (I) definiert sind, werden zunächst Verbindungen der Formel (X), worin $R^{16} = CCl_3$ ist, erhalten,

w Iche durch nachfolgende Umsetzung mit Verbindungen der Formel HNR^4R^5 (R^4 und R^5 wie in Formel (I)), zu Verbindungen der Formel (IV), worin $R^{16} = CCl_3$ bedeutet, führen.

Gegebenenfalls können analog den vorstehenden Verfahren unter 1.-4. auch Zwischenprodukte der Formel (X),

mit 2 austauschfähigen Gruppen R^{16} hergestellt werden (vgl. Formel (IV)) und die austauschfähigen Gruppen nacheinander mit geeigneten Aminen oder Ammoniak substituiert werden, um analog allgemein bekannten Verfahrensweisen zu Verbindungen der Formel (I) zu gelangen. Gegebenfalls können analog den vorstehenden Verfahren unter 1.-4. erhaltene Zwischenprodukte der Formel (X), worin R^{16} (C_1 - C_4)-Alkylthio oder Phenyl-(C_1 - C_4)-alkylthio bedeutet, durch eine Chlorierung oder Oxidation in reaktionsfähigere Derivate der Formeln (X) umgewandelt werden.

Ebenso sind nach literaturbekannten Verfahren oder nach den zuvor genannten Verfahren, wobei dann offenkettige, olefinische Derivate analog zu Verbindungen der Formel (II), (VII), (IX), in denen X eine C-C-Bindung und m=1 darstellten, eingesetzt werden, Verbindungen der Formel (XIII) herstellbar.

Die Umsetzung der Carbonsäurederivate der Formel (II) mit den Amidinothioharnstoff-Derivaten der Formel (VI) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem organischen Lösungsmittel, wie z.B. Aceton, THF, Dioxan, Acetonitril, DMF, Methanol, Ethanol, bei Temp raturen von -10 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 0 °C bis 20 °C. Die Umsetzung kann aber auch in Wasser oder in wässrigen

Lösungsmitttelgemischen mit einem oder mehreren der obengenannten organischen Lösungsmitteln erfolgen. Falls (VI) als Säureadditionssalz eingesetzt wird, kann es gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt werden. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei im Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (VI) eingesetzt. Verbindungen der Formel (III) und (VI) können beispielsweise äquimolar oder mit bis zu 2 Moläquivalenten Überschuß an Verbindung der Formel (III) eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren literaturbekannt (vergl.: H. Eilingsfeld, H. Scheuermann, Chem. Ber.; 1967, 100, 1874), die entsprechenden Zwischenprodukte der Formel (IV) sind neu.

Die Umsetzung der cyclischen Amidine der Formel (VII) mit den N-Cyanodithioiminocarbonaten der Formel (VIII) erfolgt vorzugsweise basenkatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel, wie z.B. Acetonitril, DMF, Dimethylacetamid (DMA), N-Methylpyrrolidon (NMP), Methanol und Ethanol, bei Temperaturen von -10 °C bis zum Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C. Falls (VII) als Säureadditionssalz eingesetzt wird, kann es gegebenenfalls in situ mit einer Base freigesetzt werden. Als Basen bzw. basische Katalysatoren eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (VIII) eingesetzt, Verbindungen der Formel (VIII) und (VIII) können in der Regel äquimolar oder mit 2 Moläquvalenten Überschuß an Verbindung der Formel (II) eingesetzt werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren literaturbekannt (vergl.: T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714), die entsprechenden Zwischenprodukte der Formel (IV) sind neu.

Die Herstellung von Zwischenprodukten der Formel (X) mit R¹⁶ = Chlor kann durch Reaktion von Alkali-dicyanamid mit einem cyclischen Carbonsäurederivat der Formel (II), wobei dann R¹⁵ bevorzugt die funktionelle Gruppe Carbonsäurechlorid oder Carbonsäureamid bedeutet, erfolgen. Die Umsetzung der Reaktionskomponenten erfolgt beispielsweise säurekatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt, des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, wobei die entstehend n Intermediate in situ mit einem geeigneten Chlorierungsreagenz wie beispielsweise Phosphoroxychlorid chloriert werden können. Geeignete Säuren sind z.B. Halogenwasserstoffsäuren, wie HCl, oder auch Lewis-Säuren, wie z.B. AlCl₃ oder BF₃ (vergl. US-A-5095113, DuPont).

Die Herstellung von Zwischenprodukten der Formel (X) mit R¹⁶ = Trihalogenmethyl kann durch Reaktion der entsprechenden Trihalogenessigsäurenitrile mit einem cyclischen Carbonsäurenitril der Formel (IX) erfolgen. Die Umsetzung der Reaktionskomponenten erfolgt beispielsweise säurekatalysiert in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z.B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen bei Temperaturen zwischen -40 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei -10 °C bis 30 °C. Geeignete Säuren sind z.B. Halogenwasserstoffsäuren wie HCl oder auch Lewis-Säuren wie z.B. AlCl₃ oder BF₃ (vgl. EP-A-130939, Ciba Geigy).

Zwischenprodukte der Formel (IV) oder (X), worin $R^{16}=(C_1\text{-}C_4)$ Alkylmercapto oder unsubstituiertes Phenyl- $(C_1\text{-}C_4)$ -alkylmercapto ist, können in einem inerten organischen Lösungsmittel wie z .B. Toluol, Chlorbenzol, chlorierten Kohlenwasserstoffen oder anderen bei Temperaturen zwischen -40 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittel, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, mit einem geeigneten Chlorierungsreag nz wie z.B. elementarem Chlor oder Phosporoxychlorid zu reaktionsfähigeren Chlortriazinen der Formel (IV) oder (X),

worin R^{16} = Cl ist, überführt werden (vgl. J.K. Chakrabarti, D.E. Tupper; Tetrahedron 1975, 31(16), 1879-1882).

Zwischenprodukte der Formel (IV) oder (X), wobei $R^{16}=(C_1\text{-}C_4)$ Alkylmercapto oder unsubstituiertes oder substituiertes Phenyl- $(C_1\text{-}C_4)$ -alkylmercapto oder $(C_1\text{-}C_4)$ Alkyl-phenylthio ist, können in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. chlorierten Kohlenwasserstoffen, Essigsäure, Wasser, Alkoholen, Aceton oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen 0 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise von 20 °C bis 80 °C, mit einem geeigneten Oxidationssreagenz wie z.B. m-Chlorperbenzoesäure, Wasserstoffperoxid, Kaliumperoxomonosulfat oxidiert werden (vergl.: T.A. Riley, W.J. Henney, N.K. Dalley, B.E. Wilson, R.K. Robins; J. Heterocyclic Chem.; 1986, 23 (6), 1706-1714).

Verbindungen analog der Formel (IV) erhält man auch durch selektive nucleophile Substitution einer austauschfähigen Gruppe bei Verbindungen analog der Formel (X), wobei R¹⁶ beispielsweise für Halogen, Perhalomethyl, (C_1-C_4) Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl oder andere literaturbekannte Abgangsgruppen steht, in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 10 °C bis 25 °C, gegebenfalls unter basischen Bedingungen. Als Basen eignen sich dabei Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (X) eingesetzt; das Nucleophil wird in der Regel äquimolar bis zu 2 Moläquivalenten im Überschuß eingesetzt und kann gegebenfalls auch selbst als Base gebraucht werden. Grundsätzlich sind die entsprechenden Verfahren literaturbekannt (vergl.: V.I. Kaelarev, Dibi Ammar, A.F. Lunin; Ximinya Geterosikl. Soedin., 1985, N11, 1557 - 1563).

Analog kann man durch Substitution einer Abgangsguppe von Triazinen der Formel (IV) oder (X) mit Aziridinen der Formel (XI) gegebenfalls unter Basenzusatz in einem geeigneten inerten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril oder Mischungen hiervon bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, Aziridinyltriazine herstellen. Als Basen eignen sich Alkalihydroxide, Alkalihydride, Alkalicarbonate, Alkalialkoholate, Erdalkalihydroxide, Erdalkalihydride, Erdalkalicarbonate oder organische Basen wie Triethylamin oder 1,8-Diazabicyclo[5.4.0]undec-7-en (DBU). Die jeweilige Base wird dabei in Bereich von 1 bis 3 Moläquivalenten bezogen auf die Verbindung der Formel (IV) oder (X) eingesetzt; das Aziridin kann mit bis zu 3 Moläquvalenten überschüssig eingesetzt und gegebenfalls auch selbst als Base gebraucht werden. Nachfolged kann der Aziridin-Ring geöffnet werden. Hierzu werden beispielsweise in einem geeigneten Lösungsmittel wie z.B. THF, Dioxan, Alkohole, DMF oder Acetonitril die Zwischenverbindungen mit Nucleophilen der Formel (XII) bei Temperaturen zwischen -10 °C und dem Siedepunkt des Lösungsmittels, vorzugsweise bei 20 °C bis 80 °C, zur Reaktion gebracht. Das Verfahren der Ringöffnung ist im Prinzip bekannt (vergl.: M.D. Nair, J.D. Nagarajan, Indian J. Chem.; 1985, 24B, 940; oder JP 03005466; Chem. Abstracts 115:4914); neu ist die Ringöffnung bei Triazinylderivaten.

Zur Herstellung der Säureadditionssalze der Verbindungen der Formel (I) kommen folgende Säuren in Frage: Halogenwasserstoffsäuren wie Chlorwasserstoffsäure oder Bromwasserstoffsäure, weiterhin Phosphorsäure, Salpetersäure, Schwefelsäure, mono- oder bifunktionelle Carbonsäuren und Hydroxycarbonsäuren wie Essigsäure, Maleinsäure, Bernsteinsäure, Fumarsäure, Weinsäure, Citronensäure, Salicylsäure, Sorbinsäure oder Milchsäure, sowie Sulfonsäuren wie p-Toluolsulfonsäure oder 1,5-Naphtalindisulfonsäure. Die Säureadditionsverbindungen der Formel (I) können in einfacher Weise nach den üblichen Salzbildungsmethod n, z.B. durch Lösen einer V rbindung der Formel (I) in einem geeigneten organischen Lösungsmittel wie z.B. Methanol, Aceton, Methylenchlorid oder Benzin und Hinzufügen der Säure bei Temperaturen von

O bis 100 °C erhalten werden und in bekannter Weise, z.B. durch Abfiltrieren, isoliert und gegebenfalls durch Waschen mit einem inerten organischen Lösemittel gereinigt werden.

Die Basenadditionssalze der Verbindungen der Formel (I) werden vorzugsweise in inerten polaren Lösungsmitteln wie z.B. Wasser, Methanol oder Aceton bei Temperaturen von 0 bis 100 °C hergestellt. Geeignete Basen zur Herstellung der erfindungsgemäßen Salze sind beispielsweise Alkalicarbonate, wie Kaliumcarbonat, Alkali- und Erdalkalihydroxide, z.B. NaOH oder KOH, Alkali- und Erdalkalihydride, z.B. NaH, Alkali- und Erdalalkoholate, z.B. Natriummethanolat, Kalium-tert.Butylat, oder Ammoniak oder Ethanolamin.

Mit den in den vorstehenden Verfahrensvarianten bezeichneten "inerten Lösungsmitteln" sind jeweils Lösungsmittel gemeint, die unter den jeweiligen Reaktionsbedingungen inert sind, jedoch nicht unter beliebigen Reaktionsbedingungen inert sein müssen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und deren Salze, im folgenden zusammen als (erfindungsgemäße) Verbindungen der Formel (I) bezeichnet, weisen eine ausgezeichnete herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger mono- und dikotyler Schadpflanzen auf. Auch schwer bekämpfbare perennierende Unkräuter, die aus Rhizomen, Wurzelstöcken oder anderen Dauerorganen austreiben, werden durch die Wirkstoffe gut erfaßt. Dabei ist es gleichgültig, ob die Substanzen im Vorsaat-, Vorauflauf- oder Nachauflaufverfahren ausgebracht werden.

Im einzelnen seien beispielhaft einige Vertreter der mono- und dikotylen Unkrautflora genannt, die durch die erfindungsgemäßen Verbindungen kontrolliert werden können, ohne daß durch die Nennung eine Beschränkung auf bestimmte Arten erfolgen soll.

Auf der Seite der monokotylen Unkrautarten werden z.B. Avena, Lolium, Alopecurus, Phalaris, Echinochloa, Digitaria, Setaria sowie Cyperusarten aus der WO 97/00254 PCT/EP96/02479

32

annu Ilen Gruppe und auf seiten der perennierenden Spezies Agropyron, Cynodon, Imperata sowie Sorghum und auch ausdauernde Cyperusarten gut erfaßt.

Bei dikotylen Unkrautarten erstreckt sich das Wirkungsspektrum auf Arten wie z.B. Galium, Viola, Veronica, Lamium, Stellaria, Amaranthus, Sinapis, Ipomoea, Matricaria, Abutilon und Sida auf der annuellen Seite sowie Convolvulus, Cirsium, Rumex und Artemisia bei den perennierenden Unkräutern.

Unter den spezifischen Kulturbedingungen im Reis vorkommende Unkräuter wie z.B. Sagittaria, Alisma, Eleocharis, Scirpus und Cyperus werden von den erfindungsgemäßen Wirkstoffen ebenfalls hervorragend bekämpft.

Werden die erfindungsgemäßen Verbindungen vor dem Keimen auf die Erdoberfläche appliziert, so wird entweder das Auflaufen der Unkrautkeimlinge vollständig verhindert oder die Unkräuter wachsen bis zum Keimblattstadium heran, stellen jedoch dann ihr Wachstum ein und sterben schließlich nach Ablauf von drei bis vier Wochen vollkommen ab.

Bei Applikation der Wirkstoffe auf die grünen Pflanzenteile im Nachauflaufverfahren tritt ebenfalls sehr rasch nach der Behandlung ein drastischer Wachstumsstop ein und die Unkrautpflanzen bleiben in dem zum Applikationszeitpunkt vorhandenen Wachstumsstadium stehen oder sterben nach einer gewissen Zeit ganz ab, so daß auf diese Weise eine für die Kulturpflanzen schädliche Unkrautkonkurrenz sehr früh und nachhaltig beseitigt wird.

Obgleich die erfindungsgemäßen Verbindungen eine ausgezeichnete herbizide Aktivität gegenüber mono- und dikotylen Unkräutern aufweisen, werden Kulturpflanzen wirtschaftlich bedeutender Kulturen wie z.B. Weizen, Gerste, Roggen, Reis, Mais, Zuckerrübe, Baumwolle und Soja nur unwesentlich oder gar nicht geschädigt. Die vorliegenden Verbindungen eignen sich aus diesen

WO 97/00254 PCT/EP96/02479

33

Gründen sehr gut zur selektiven Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Nutzpflanzungen.

Darüberhinaus weisen die erfindungsgemäßen Substanzen hervorragende wachstumsregulatorische Eigenschaften bei Kulturpflanzen auf. Sie greifen regulierend in den pflanzeneigenen Stoffwechsel ein und können damit zur gezielten Beeinflussung von Pflanzeninhaltsstoffen und zur Ernteerleichterung wie z.B. durch Auslösen von Desikkation und Wuchsstauchung eingesetzt werden. Desweiteren eignen sie sich auch zur generellen Steuerung und Hemmung von unerwünschtem vegetativen Wachstum, ohne dabei die Pflanzen abzutöten. Eine Hemmung des vegetativen Wachstums spielt bei vielen monound dikotylen Kulturen eine große Rolle, da das Lagern hierdurch verringert oder völlig verhindert werden kann.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen können in Form von Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, versprühbaren Lösungen, Stäubemitteln oder Granulaten in den üblichen Zubereitungen angewendet werden. Gegenstand der Erfindung sind deshalb auch herbizide und pflanzenwachstumsregulierende Mittel, die Verbindungen der Formel (I) enthalten.

Die Verbindungen der Formel (I) können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem welche biologischen und/oder chemisch-physikalischen Parameter vorgegeben sind. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen beispielsweise in Frage: Spritzpulver (WP), wasserlösliche Pulver (SP), wasserlösliche Konzentrate, emulgierbare Konzentrate (EC), Emulsionen (EW), wie Öl-in-Wasser- und Wasser-in-Öl-Emulsionen, versprühbare Lösungen, Suspensionskonzentrate (SC), Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis, ölmischbare Lösungen, Kapselsuspensionen (CS), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate für die Streu- und Bodenapplikation, Granulate (GR) in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), wasserlösliche Granulate (SG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln und Wachse.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und werden beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986, Wade van Valkenburg, "Pesticide Formulations", Marcel Dekker, N.Y., 1973; K. Martens, "Spray Drying" Handbook, 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel wie Inertmaterialien, Tenside,
Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und werden
beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents
and Carriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J., H.v. Olphen, "Introduction
to Clay Colloid Chemistry"; 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; C. Marsden,
"Solvents Guide"; 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1963; McCutcheon's "Detergents
and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood,
"Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964;
Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell.,
Stuttgart 1976; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7,
C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, wie z.B. Insektiziden, Akariziden, Herbiziden, Fungiziden, sowie mit Safenern, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix.

Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Tenside ionischer und/oder nichtionischer Art (Netzmittel, Dispergiermittel), z.B. polyoxyethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, polyoxethylierte Fettamine, Fettalkoholpolyglykolethersulfate, Alkansulfonate, Alkylbenzolsulfonate, ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium, dibutylnaphthalin-sulfonsaures Natrium oder auch oleoylmethyltaurinsaures Natrium enthalten. Zur Herstellung der Spritzpulver werden die herbiziden

Wirkstoffe beispielsweise in üblichen Apparaturen wie Hammermühlen, Gebläsemühlen und Luftstrahlmühlen feingemahlen und gleichzeitig oder anschließend mit den Formulierungshilfsmitteln vermischt.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem

organischen Lösungsmittel z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen oder Mischungen der organischen Lösungsmittel unter Zusatz von einem oder mehreren Tensiden ionischer und/oder nichtionischer Art (Emulgatoren) hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calzium-Salze wie Ca-dodecylbenzolsulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanester wie z.B. Sorbitanfettsäureester oder Polyoxethylensorbitanester wie z.B. Polyoxyethylensorbitanfettsäureester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit und Pyrophyllit, oder Diatomeenerde.

Suspensionskonzentrate können auf Wasser- oder Ölbasis sein. Sie können beispielsweise durch Naß-Vermahlung mittels handelsüblicher Perlmühlen und gegebenenfalls Zusatz von Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, hergestellt werden.

Emulsionen, z.B. Öl-in-Wasser-Emulsionen (EW), lassen sich beispielsweise mittels Rührern, Kolloidmühlen und/oder statischen Mischern unter Verwendung von wäßrigen organischen Lösungsmitteln und gegebenenfalls Tensiden, wie sie z.B. oben bei den anderen Formulierungstypen bereits aufgeführt sind, herstellen.

Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise - gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln - granuliert werden.

Wasserdispergierbare Granulate werden in der Regel nach den üblichen Verfahren wie Sprühtrocknung, Wirbelbett-Granulierung, Teller-Granulierung, Mischung mit Hochgeschwindigkeitsmischern und Extrusion ohne festes Inertmaterial hergestellt.

Zur Herstellung von Teller-, Fließbett-, Extruder- und Sprühgranulate siehe z.B. Verfahren in "Spray-Drying Handbook" 3rd ed. 1979, G. Goodwin Ltd., London; J.E. Browning, "Agglomeration", Chemical and Engineering 1967, Seiten 147 ff; "Perry's Chemical Engineer's Handbook", 5th Ed., McGraw-Hill, New York 1973, S. 8-57.

Für weitere Einzelheiten zur Formulierung von Pflanzenschutzmitteln siehe z.B. G.C. Klingman, "Weed Control as a Science", John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, Seiten 81-96 und J.D. Freyer, S.A. Evans, "Weed Control Handbook", 5th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1968, Seiten 101-103.

Die agrochemischen Zubereitungen enthalten in der Regel 0,1 bis 99 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 95 Gew.-%, Wirkstoff der Formel (I). In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration z.B. etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 1 bis 90, vorzugsweise 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten 1 bis 30 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise meistens 5 bis 20 Gew.-%

an Wirkstoff, versprühbare Lösungen enthalten etwa 0,05 bis 80, vorzugsweise 2 bis 50 Gew.-% Wirkstoff. Bei wasserdispergierbaren Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden. Bei den in Wasser dispergierbaren Granulaten liegt der Gehalt an Wirkstoff beispielsweise zwischen 1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 10 und 80 Gew.-%.

Daneben enthalten die genannten Wirkstofformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Konservierungs-, Frostschutz- und Lösungsmittel, Füll-, Träger- und Farbstoffe, Entschäumer, Verdunstungshemmer und den pH-Wert und die Viskosität beeinflussende Mittel.

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Mischungsformulierungen oder im Tank-Mix sind beispielsweise bekannte Wirkstoffe einsetzbar, wie sie in z.B. aus Weed Research 26, 441-445 (1986), oder "The Pesticide Manual", 10th edition, The British Crop Protection Council and the Royal Soc. of Chemistry, 1994 und dort zitierter Literatur beschrieben sind. Als literaturbekannte Herbizide, die mit den Verbindungen der Formel (I) kombiniert werden können, sind z.B. folgende Wirkstoffe zu nennen (Anmerkung: Die Verbindungen sind entweder mit dem "common name" nach der International Organization for Standardization (ISO) oder mit dem chemischen Namen, ggf. zusammen mit einer üblichen Codenummer bezeichnet):

acetochlor; acifluorfen; aclonifen; AKH 7088, d.h. [[[1-[5-[2-Chloro-4-(trifluoromethyl)-phenoxy]-2-nitrophenyl]-2-methoxyethylidene]-amino]-oxy]-essigsäure und -essigsäuremethylester; alachlor; alloxydim; ametryn; amidosulfuron; amitrol; AMS, d.h. Ammoniumsulfamat; anilofos; asulam; atrazin; azimsulfurone (DPX-A8947); aziprotryn; barban; BAS 516 H, d.h. 5-Fluor-2-phenyl-4H-3,1-benzoxazin-4-on; benazolin; benfluralin; benfuresate; bensulfuron-methyl; bensulide; bentazone; benzofenap; benzofluor; benzoyl-

prop-ethyl; benzthiazuron; bialaphos; bifenox; bromacil; bromobutide; bromofenoxim; bromoxynil; bromuron; buminafos; busoxinone; butachlor; butamifos; butenachlor; buthidazole; butralin; butylate; cafenstrole (CH-900); carbetamide; cafentrazone (ICI-A0051); CDAA, d.h. 2-Chlor-N,Ndi-2-propenylacetamid; CDEC, d.h. Diethyldithiocarbaminsäure-2-chlorallylester; chlomethoxyfen; chloramben; chlorazifop-butyl, chlormesulon (ICI-A0051); chlorbromuron; chlorbufam; chlorfenac; chlorflurecol-methyl; chloridazon; chlorimuron ethyl; chlornitrofen; chlorotaluron; chloroxuron; chlorpropham; chlorsulfuron; chlorthal-dimethyl; chlorthiamid; cinmethylin; cinosulfuron; clethodim; clodinafop und dessen Esterderivate (z.B. clodinafop-propargyl); clomazone; clomeprop; cloproxydim; clopyralid; cumyluron (JC 940); cyanazine; cycloate; cyclosulfamuron (AC 104); cycloxydim; cycluron; cyhalofop und dessen Esterderivate (z.B. Butylester, DEH-112); cyperquat; cyprazine; cyprazole; daimuron; 2,4-DB; dalapon; desmedipham; desmetryn; di-allate; dicamba; dichlobenil; dichlorprop; diclofop und dessen Ester wie diclofop-methyl; diethatyl; difenoxuron; difenzoquat; diflufenican; dimefuron; dimethachlor; dimethametryn; dimethenamid (SAN-582H); dimethazone, clomazon; dimethipin; dimetrasulfuron, dinitramine; dinoseb; dinoterb; diphenamid; dipropetryn; diquat; dithiopyr; diuron; DNOC; eglinazine-ethyl; EL 77, d.h. 5-Cyano-1-(1,1-dimethylethyl)-N-methyl-1H-pyrazole-4-carboxamid; endothal; EPTC; esprocarb; ethalfluralin; ethametsulfuron-methyl; ethidimuron; ethiozin; ethofumesate; F5231, d.h. N-[2-Chlor-4-fluor-5-[4-(3-fluorpropyl)-4,5dihydro-5-oxo-1H-tetrazol-1-yl]-phenyl]-ethansulfonamid; ethoxyfen und dessen Ester (z.B. Ethylester, HN-252); etobenzanid (HW 52); fenoprop; fenoxan, fenoxaprop und fenoxaprop-P sowie deren Ester, z.B. fenoxaprop-P-ethyl und fenoxaprop-ethyl; fenoxydim; fenuron; flamprop-methyl; flazasulfuron; fluazifop und fluazifop-P und deren Ester, z.B. fluazifop-butyl und fluazifop-P-butyl; fluchloralin; flumetsulam; flumeturon; flumiclorac und dessen Ester (z.B. Pentylester, S-23031); flumioxazin (S-482); flumipropyn; flupoxam (KNW-739); flu rodifen; fluoroglycofen- thyl; flupropacil (UBIC-4243); fluridone; flurochloridone; flur xypyr; flurtamone; fomesafen; fosamine; furyloxyfen; glufosinate; glyphosate; halosafen; halosulfuron und dessen Ester (z.B.

Methylester, NC-319); haloxyfop und dessen Ester; haloxyfop-P (= Rhaloxyfop) und dessen Ester; hexazinone; imazamethabenz-methyl; imazapyr; imazaquin und Salze wie das Ammoniumsalz; imazethamethapyr; imazethapyr; imazosulfuron; ioxynil; isocarbamid; isopropalin; isoproturon; isoxaben; isoxapyrifop; karbutilate; lactofen; lenacil; linuron; MCPA; MCPB; mecoprop; mefenacet; mefluidid; metamitron; metazachlor; methabenzthiazuron; metham; methazole; methoxyphenone; methyldymron; metabenzuron, methobenzuron; metobromuron; metolachlor; metosulam (XRD 511); metoxuron; metribuzin; metsulfuron-methyl; MH; molinate; monalide; monocarbamide dihydrogensulfate; monolinuron; monuron; MT 128, d.h. 6-Chlor-N-(3-chlor-2propenyl)-5-methyl-N-phenyl-3-pyridazinamin; MT 5950, d.h. N-[3-Chlor-4-(1methylethyl)-phenyl]-2-methylpentanamid; naproanilide; napropamide; naptalam; NC 310, d.h. 4-(2,4-dichlorbenzoyl)-1-methyl-5-benzyloxypyrazol; neburon; nicosulfuron; nipyraclophen; nitralin; nitrofen; nitrofluorfen; norflurazon; orbencarb; oryzalin; oxadiargyl (RP-020630); oxadiazon; oxyfluorfen; paraquat; pebulate; pendimethalin; perfluidone; phenisopham; phenmedipham; picloram; piperophos; piributicarb; pirifenop-butyl; pretilachlor; primisulfuron-methyl; procyazine; prodiamine; profluralin; proglinazine-ethyl; prometon; prometryn; propachlor; propanil; propaquizafop und dessen Ester; propazine; propham; propisochlor; propyzamide; prosulfalin; prosulfocarb; prosulfuron (CGA-152005); prynachlor; pyrazolinate; pyrazon; pyrazosulfuron-ethyl; pyrazoxyfen; pyridate; pyrithiobac (KIH-2031); pyroxofop und dessen Ester (z.B. Propargylester); quinclorac; quinmerac; quinofop und dessen Esterderivate, quizalofop und quizalofop-P und deren Esterderivate z.B. quizalofop-ethyl; quizalofop-P-tefuryl und -ethyl; renriduron; rimsulfuron (DPX-E 9636); S 275, d.h. 2-[4-Chlor-2-fluor-5-(2-propynyloxy)-phenyl]-4,5,6,7-tetrahydro-2H-indazol; secbumeton; sethoxydim; siduron; simazine; simetryn; SN 106279, d.h. 2-[[7-[2-Chlor-4-(trifluor-methyl)-phenoxy]-2-naphthalenyl]-oxy}-propansäure und -methylester; sulfentrazon (FMC-97285, F-6285); sulfazuron; sulfometuronmethyl; sulfosate (ICI-A0224); TCA; tebutam (GCP-5544); tebuthiuron; terbacil; terbucarb; terbuchlor; terbumeton; terbuthylazine; terbutryn; TFH 450, d.h. N,N-Diethyl-3-[(2-ethyl-6-methylphenyl)-sulfonyl]-1H-1,2,4-triazol-1-carboxamid;

thenylchlor (NSK-850); thiazafluron; thizopyr (Mon-13200); thidiazimin (SN-24085); thifensulfuron-methyl; thiobencarb; tiocarbazil; tralkoxydim; tri-allate; triasulfuron; triazofenamide; tribenuron-methyl; triclopyr; tridiphane; trietazine; trifluralin; triflusulfuron und Ester (z.B. Methylester, DPX-66037); trimeturon; tsitodef; vernolate; WL 110547, d.h. 5-Phenoxy-1-[3-(trifluormethyl)-phenyl]-1H-tetrazol; UBH-509; D-489; LS 82-556; KPP-300; NC-324; NC-330; KH-218; DPX-N8189; SC-0774; DOWCO-535; DK-8910; V-53482; PP-600; MBH-001; KIH-9201; ET-751; KIH-6127 und KIH-2023.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Formulierungen gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und wasserdispergierbaren Granulaten mittels Wasser. Staubförmige Zubereitungen, Boden- bzw. Streugranulate sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit, der Art des verwendeten Herbizids, u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge der Verbindungen der Formel (I). Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,001 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,005 und 5 kg/ha.

A. Chemische Beispiele

Beispiel 1

2-Amino-4-(2-methyl-1-oxaspiro[2.4]heptan-2-yl)-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin

- a) 9,3 g (0,11 mol) Cyclopentanon und 13,5 g (0,11 mol)
 2-Chlorpropionsäure-methylester werden auf 0 bis 2 °C gekühlt, bei dieser
 Temperatur werden unter Rühren 13,6 g (0,12 mol) Kalium-tert.-butylat,
 suspendiert in 200 ml Tetrahydrofuran, langsam in einem Zeitraum von ca.
 90 min. zugetropft, anschließend wird noch 60 Minuten ohne Kühlung weiter
 gerührt. Zum Reaktionsgemisch wird etwas Wasser zugeben, diese Mischung
 wird mit Diethylether extrahiert, die organische Phase mit Natriumsulfat
 getrocknet, das Trockenmittel wird abfiltriert und nach Abdampfen des
 Lösungsmittel erhält man 10,6 g 2-Methyl-1-oxaspiro[2.4]heptan-2carbonsäuremethylester, welcher ohne weitere Reinigung in der Folgestufe
 eingesetzt werden kann (siehe b).
- b) Zu 5,4 g (0,018 mol) 2-Biguanidino-1-(3,5-dimethylphenoxy)-propanhydrochlorid in 50 ml Methanol und 6 g gemahlenem Molsieb 3A wird eine aus 0,86 g (0,036 mol) Natrium und 50 ml Methanol hergestellte Methanolatlösung gegeben. Nachfolgend fügt man 5,3 g (0,028 mol) 2-Methyl-1-oxaspiro[2.4]heptan-2-carbonsäuremethylester hinzu und rührt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltiriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als Laufmittel 1,8 g (25 % d.Th.) 2-Amino-4-(2-methyl-1-oxaspiro[2.4]heptan-2-yl)-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin.

Beispiel 19

2-Amino-4-cyclobutyl-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin

Zu 7,2 g (0,025 mol) 2-Biguanidino-1-(3,5-dimethylphenoxy)-propanhydrochlorid in 50 ml Methanol und 7 g gemahlenem Molsieb 3A wird eine aus 1,2 g (0,05 mol) Natrium und 100 ml Methanol hergestellte Methanolatiösung gegeben. Nachfolgend fügt man 5,2 g (0,045 mol) Cyclobutancarbonsäure-ethylester hinzu und rührt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltiriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als Laufmittel 3,5 g (39 % d.Th.) 2-Amino-4-cyclobutyl-6-(1-(3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin.

Beispiel 29

2-Amino-4-cyclopropyl-6-(1-(4-chlor-3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin

Zu 10,3 g (0,03 mol) 2-Biguanidino-1-(4-chlor-3,5-dimethylphenoxy)-propanhydrochlorid in 50 ml Ethanol und 10 g gemahlenem Molsieb 3A wird eine aus 1,5 g (0,06 mol) Natrium und 100 ml Ethanol hergestellte Ethanolatlösung gegeben. Nachfolgend fügt man 5,2 g (0,045 mol) Cyclopropancarbonsäure-ethylester hinzu und rührt 2 Stunden bei 25 °C, dann 4 Stunden bei 65 °C. Die Reaktionsmischung wird filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand mit Essigester aufgenommen. Diese Lösung wird mit Wasser gewaschen, die organische Phase abgetrennt und mit Natriumsulfat getrocknet. Das Trockenmittel wird abfiltiriert und die Essigesterphase eingedampft. Man erhält nach säulenchromatographischer Trennung über Kieselgel mit Essigester als

Laufmittel 1,5 g (14 % d.Th.) 2-Amino-4-cyclopropyl-6-(1-(4-chlor-3,5-dimethylphenoxy)-propyl-2-amino)-1,3,5-triazin.

Die in der Tabelle 1 beschriebenen Verbindungen erhält man analog zu den vorstehenden Beispielen 1, 19 und 29. In der Tabelle bedeuten:

Nr. = Beispiel oder Beispielnummer

Fp. = Festpunkt (Schmelzpunkt) in °C oder eine Angabe zum Aggregatzustand oder eine andere Angabe,

z. B. I, II = Diastereomer(engemisch) I oder II

Me = Methyl

Et = Ethyl

Pr = Propyl

i-Pr = Isopropyl

c-Pr = Cyclopropyl

t-Bu = tertiär-Butyl

Ph = Phenyl

Ziffern = 1. Ziffer vor Substituenten bedeutet Position des

Substituenten am Aromaten

2. Ziffer vor Heterocyclenresten bedeutet

Radikalposition in bezug auf Heteroatom, z. B.

2-Pyridinyl = -2-pyridin = Pyridin-2-yl

Cyclobutylen = Cyclobut-1,1-diyl

Cyclopentylen = Cyclopent-1,1-diyl

Cyclohexylen = Cyclohex-1,1-diyl

44

Morpholino =
$$-morpholin = -N$$

Piperidino = -piperidin =
$$-N$$

2-Thienyl = -2-thieno =
$$-\frac{1}{5}$$

Tabelle 1: Verbindungen der Formel (I)

		Fp.	80 - 81				110	111	flüssig	flüssig	flüssig	58 - 62				
		>	0		0	ı	0		0		0	0		0	0	
	<u> </u>	×	0		0		CMe ₂		CMe ₂	CMe ₂	CH ₂	GH2		0	0	
	ر و د د د	(R ⁹) _n	3,5-Me ₂	•	3,5-Me,	4	3,5-Me ₂		2,4-Me ₂	3,4-(MeO) ₂	3,5-Me ₂			3,5-Me ₂	T	
	\uparrow	R ⁸	I		Ξ		Ŧ		H	I	I	Ξ		Me	Me	
3) _m	R	R ⁷	Me		Me	_	Me		I	I	Me	Me		Me	Me	
(-(cr²r³)	N N R ⁶ –	R ⁶	I		Ŧ		I		H	Ŧ	I	I		I	H	
(`\).	Z - Z	RS	I		I		I		I	Н	н	I		Н	I	
	R ⁴ R ⁵ N	R ⁴	I		Ξ		I		Ξ	H.	H	Ŧ		I	I	
		(CR ² R³),	Cyclo-	pentylen	Cyclo-	hexyten	CHCH = CMe2		CHCH = CMe ₂	CHCH = CMe2	ccı ₂	ະເວາ		CEt,	CHEt	
		R¹	Me		Me		Н		r	I	Ме	Me		CI	CI	
		Ž.			2		3		4	2	9	1 2	1	8	6	

L	ı										
ž	٦.	(CR*R*) _m	č	o CC	ê.	æ	æ.	(R ⁹),	×	٨	Fp.
5	Ü	CHEt	I	I	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
=	ū	CHEt	I	Ξ	I	Ξ	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
12	Ι	CF ₂	I	Ξ	I	Me	I	3,5-Me ₂	В	0	fest
13	Me	сн₂	H	I	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	52-55
14	Me	CH ₂	H	I	Ξ	Ξ	Ξ	3-Me,	GH ₂	0	
								4,5-0CH ₂ -0-			
15	L	CH ₂	Н	I	I	Me	Me	3,5-Me ₂	ਲੇ	0	
16	Et	CH ₂	I	Ŧ	CH ₂ OMe	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
17	I	CH ₂	I	I	I	I	I		CH ₂	0	
								4,5-0CH ₂ 0-	1		
18	ı.	CH ₂	H	I	Ξ	-(CH ₂) ₄ -	214-	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
19	н	CH ₂ CH ₂	I	I	Ξ	Me	I	3,5-Me ₂	ਦ ,	0	flüssia
20	Me	Д 2	I	I	I	Ŧ	I	4,5-Me,	· \ \f	C	
21	Me	CH ₂	I	I	I	Me	I		N-Me	0	
22	Me	CH ₂	Ξ	I	I	Me	Ŧ	,	Ğ,	0	
23	Me	CH ₂	I	I	I	Me	I	\top	. કે	0	
24	4	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ	T		0	
25	Me	CH ₂	I	I	=	Me	Ξ		3,	0	fest
5								4-CI			
97	Me	CH ₂	=	Ŧ	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	NI	

Ž	la)	1002031	104	50	Lak						
	۲.	שי ער ארון	۲.	<u> </u>	,	àc	ž.	(R ³),	×	>	Fp.
27	I	CH ₂	I	Ξ	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	д ,	0	fest
28	Me	CH ₂	I	Ŧ	I	Me	I	3,5-Me ₂	0	S	
29	I	CH ₂	I	I	I	Me	I	3,5-Me2,	ਤੇ,	0	143 -
ļ								4-C	•		144
30	n-Pr	CH ₂	H	Ξ	I	Ξ	I	3,5-Me ₂	ਲ,	0	
31	Me	CH ₂	I	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂ ,	CH ₂	0	
l				,				4-CI			•
32	£	CH ₂	н	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	GH ₂	0	63-65
33	ОМе	CH ₂	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH,	0	
34	Me	CH ₂	I	I	I	Ę	I	3,5-Me ₂	Ğ,	0	
35	Me	сн ₂	I	Ξ	Me	I	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
36	Me	CH ₂	Ŧ	Ξ	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me,	ਲ	NMa	
37	≥	E.]]	3			7	75		
		7	=		<u> </u>	e ∑	I	3,4,5-Me ₃	СН ₂	0	115.
[116
ຊຸ	Zie	CH ₂	СНО	I	Ξ	표	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
39	I	CH ₂ CH ₂ CH ₂	I	I	H	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	flüssio
40	T	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ	3,5-Me,	हैं,	0	fliteein
41	Me	CH ₂	I	I	Ξ	Me	I		N-Me	0	2
42	Me	CH ₂	I	I	I	i.P.	Ŧ		ਜੁ	0	
ĺ									,	, -	

ž	R¹	(CR ² R ³) _m	R4	R5	Re	R7	g.	(R ⁹) _n	×	٨	Fp.
43	I	CH ₂	I	I	Ξ	Ι	Ξ	3-Me,	0	0	
								4,5-0CH ₂ 0-		·	
44	Me	СН2	I	н	СНО	Ψ	I	3,5-Me ₂	0	0	
45	Ľ	СН2	H	COMe	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH2	0	
46	Me	CH ₂	H	H	I	Me	Ξ	4-t-Bu	GH,	0	
47	Me	сн2сн2	I	H	I	Me	I	4-t-Bu	G,	0	
48	Me	СН2	н	н	I	Me	Ι	4-t-Bu	CH ₂	S	
49	Me	CH ₂	I	н	н	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	87 - 90
20	Me	CH ₂	I	I	Н	-(CH2)4-	214-	3,5-Me ₂	CH ₂	0	104 -
											106
51	Me	CH ₂	Me	Me	н	H	I	3,4,5-Me ₃	CH ₂	0	
25	ОМе	CH ₂	Н	H	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
53	ОМе	сн2сн2сн2	Н	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
54	Ŧ	СН2	н	СНО	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
55	Me	CH ₂	Me	Me	I	Ι	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
26	Me	CH ₂	н	Н	Me	I	Ŧ	2,3-Me ₂	CH ₂	0	
57	Me	CH ₂	Et	Et	Ŧ	I	H	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
58	Me	CH ₂	I	I	Me	I	I	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
59	ů.	CH ₂	I	I	I	Me	Ξ	3,4,5-Me ₃	CH ₂	0	

Fp.						fest	fest	fest	fest	fest	fest 124 -	fest 124 -	fest 124 - 126	fest 124 - 126	fest 124 - 126	fest 124 - 126	fest 124 - 126 flüssig	fest 124 - 126 flüssig flüssig	fest 124 - 126 flüssig flüssig	fest 124 - 126 flüssig flüssig
>	S		0	0 GH2	0 G ₂	0 8 0	0 5 0 0	0 5 0 0	0 5 0 0 0	o 5 o o 5	0 5 0 0 5 0	0 5 0 0 5 0	0 5 0 0 0 5 0				ο δ ο ο ο δ ο ο ο ο ο σ σ			
	유,	3	2	G 2	CH ₂	CH ₂	CH C	CH C	CH2	G G G G G G G G G G G G G G G G G G G	G G <td>G. 2.3 G. 2.3<</td> <td>GR 2 GR 2 <th< td=""><td>G G G G G G G G G G G G G G</td><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td></th<></td>	G. 2.3 G. 2.3<	GR 2 GR 2 <th< td=""><td>G G G G G G G G G G G G G G</td><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td><td></td></th<>	G G G G G G G G G G G G G G						
	3,4,5-Me ₃	3,5-Me ₂		3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ , 4-Cl	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ , 4-Cl 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 2,4-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 2,4-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 2,4-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 3,5-Me ₂ 4-Cl 3,5-Me ₂	3,5-Me ₂
	I	I	Ξ		Ξ	I	I I I	I I I	x x x	T T T T	x x x x x	x x x x	x x x x x	x x x x x x		x x x x x x x x	x x x x x x x x x	x x x x x x x x x x		
	Me	Ξ	Me		Ef	Me Et	Me K	Me Me	Me Me	T We We Et	E S S I	T Me Me	Me Me II I	I Me Me I I	E S E E E E	Me T I Me T I Me	A A B T T A B T T A B B	T W T T W T T	Ma T Ma T T Ma T Ma T Ma	T Me T T Me T T Me T T
	I	I	I		II.	I. I	I I I	I I I	Н Н СН ₂ ОМе	Н Н СН ₂ ОМе	Н Н Н Н	Н Н Н Н	Н Н Н Н СН ₂ ОМе	Н Н Н СН ₂ ОМе	Н Н СН ₂ ОМе Н	Н Н Н Н Н Н СН ₂ ОМе	Н Н Н СН ₂ ОМе Н Н СНО	H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н	H Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н Н
R _D	I	Ι	I		I	I I	I I I	ı ı ı	I I I I	I I I I I	<u> </u>	I I I I I	<u> </u>	<u> </u>	I I I I I I I S	I I I I I I I S I				
Ω.	I	I	H		H	I I	<u> </u>	I I I	x	x x x x x	<u> </u>	<u> </u>	<u> </u>	<u> </u>	T I I I I I E	I I I I I I S I	<u> </u>	<u> </u>	<u> </u>	<u> </u>
שי ע עטו	CH ₂	CH ₂	CH ₂		CH ₂	CH ₂	CH ₂ CH ₂	СН ₂ СН ₂	СН ₂ СН ₂	СН ₂	유 ₂	용 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명	용 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명	유 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명	유 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명 명	3 3 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 5 6 6 6 7 8 8 9 9 10	GH2 GH2 GH3 GH3	GH2 GH2 GH3 GH3 GH4 GH5 GH6 GH7 GH8 GH8 GH9 GH9 </td <td>64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 65. 66. 67. 68. 69. 64. 64. 65. 66. 67. 68. 69. <!--</td--><td>3 3 3 4 3 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 5 6 6 7 8 8 9 10</td></td>	64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 64. 65. 66. 67. 68. 69. 64. 64. 65. 66. 67. 68. 69. </td <td>3 3 3 4 3 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 5 6 6 7 8 8 9 10</td>	3 3 3 4 3 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 5 6 6 7 8 8 9 10
	Me	i-Pr	L.		T.							ص ص	ص ص ص							
7	8	19	62	_																

Š	R1	(CR ² R ³) _m	R ⁴	R5	Re	R7	R8	(R ⁹),	×	<u> </u>	En
11	Me	CH ₂	Ŧ	포	Ξ	Ξ	Ξ	2,3-Me ₂	કેં	0	
78	Şe	CH ₂	Ξ	Ξ	Ξ	Me	I	2,3-Me ₂	Ğ,	0	
79	ОМе	CH ₂	Ξ	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	. 0	0	
8	Me	CH2CH2	Ξ	Ŧ	Ξ	I	Μe	2,3-Me ₂	ਤੰ	0	
8	OMe	CH ₂	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	GH,	0	
82	н	CH ₂	I	Ξ	I	I	Ŧ	3,4-(MeO) ₂	ਚ,		fest
83	CI	CH(i-Pr)	I	Ξ	Ξ	Me	Me	3,5-Me ₂	0	0	
84	Ξ	CMeCF ₃	Ξ	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	GH,	0	flüssig
82	Me	СНМе	Н	I	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	flüssig
98	Me	CHMe	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	0	S	
87	I	СНМе	H	I	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂ ,	CH ₂	0	58 - 60
								4 -C		-	
88	Ŧ	CHMe	I	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂	GH ₂	0	flüssig
83	ıL	СНМе	I	H	I	Me	I	3,5-Me ₂	CH,	£,	
90	Me	CHMe	I	I	Ē	Me	Me	3,5-Me ₂	0	. 0	
91	Me	CMe ₂	Me	Me	Ŧ	I	=		ъ,	0	
92	I	CMe ₂	I	I	I	Me	I	T	. 0	0	fest
93	Me	CMe ₂	I	I	Me	Me	I	3,5-CI ₂	0	0	
94	Me	CMe ₂	I	I	I	Me	Ŧ		0	0	
								,			

	CH-H-0]	<u>₹</u>	R5	Re	R7	R8	(BB)	^	^	
	CMe,	I	I	1	Ma	: =	'n 2 E.MA	< 0	- (ď.
1						:	5,0-mc ₂	,	o	
	CMe ₂	I	I	H	Me	I	3,5-Me ₂	CM ₈₂	0	fest
	CMe ₂	I	H	Me	Me	βe	3,5-Me ₂	0	0	
	CMe ₂	π	I	Me	Me	Ξ	3,5-Me ₂	0	0	
	CMe ₂	I	I	Me	Me	I	4-t-Bu	0	0	
	CMe ₂	I	I	Me	Me	I	3,4,5-Me ₃	0	0	
	CMe ₂	I	Н	I	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	0	0	168 -
ı				·				-		170
	CMePh	I	I	I	I	I	2,4-Me ₂	0	0	119 -
										120
	CMePh	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	0	0	1: 153 -
										155
	CMeP	I	I	<u> </u>	æ X	I	3,5-Me ₂	0	0	II: 125 -
- [128
ļ	CHPh	I	I	Ŧ	Me	Ι	3,5-Me ₂	GF.	0	
	Cyclopentylen	H	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂ ,	0	0	77 - 78
							4-CI			
	CHMe	H	I	I	Me	Ξ	3,5-Me ₂ ,	0	0	flüssig
					·-·		4-CI)

Ž.	R¹	(CR ² R ³) _m	R4	R5	R ⁶	В7	F8	(R ⁹),	×	٨	<u>.</u>
108	Me	CMe ₂	Ξ	Ξ	Ŧ	Me	Ξ	3,5-Me ₂ ,	0	0	88-90
- 1								D-4-			
5 5	Σe	CMe ₂	Н	Ŧ	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	0	0	89 - 90
10	Me	CHMe	I	Ξ	Ξ	Me	Ι	3,5-Me ₂	0	0	64 - 65
111	ō	Cyclopentylen	I	I	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me ₂ ,	0	0	
	_							4-CI			
112	ច	CMe ₂	I	I	I	Ι	Ξ	2,4-Me ₂	0	0	
113	ਠ	CMe ₂	H	I	I	Me	I	3,5-Me ₂ ,	0	0	
1								4-CI			
114	ō	CMe ₂	I	I	I	Me	I	3,5-Me ₂	0	0	
115	ū	Cyclopentylen	I	I	I	Me	I	3,5-Me,	0	0	
116	ш	Cyclopentylen	Ξ	I	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me,	0	c	
			•					4-CI) 	<u> </u>	
117	Ľ.	CMe ₂	I	I	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me ₂ ,	0	0	
								4-CI			
118	4	CM ₈₂	H	I	I	Me	I	3,4,5-Me ₃	0	0	
119	J	CMe ₂	I	Ξ	Ξ	Me	Ξ	3,5-Me,	0	0	
120	1	Cyclopentylen	I	I	I	Me	I	3,5-Me,	0	c	
121	Me	CH ₂	I	I	I	Me	Me	3,5-Me,	GH,) 0	
122	Σ	CH ₂	Ι	I	I	Me	Me	3,5-Me,	, 0	c	
1		**************************************						7)	>	

					T		T				T	····				T			T		-
<u>6</u>			-	1	-	1	_			1	1					L	_				
٨	0	0	0) c) c) c	0	۱ 		0	5	2 E2		CHMe		Н	CHMe		GH,	7	
×	0	0	0	H.	7 0	S	G.	•	-	CHMe	DH.CH	CIPCII ₂	2	יבהירה.	COOMe	, CCI ₂	CF ₂	١.	CFCI		
(R ⁹),	3,5-Me ₂	3,5-Me,	3,5-Me,	2,3-(CH ₂) _E	2,3-(CH.),	2,3-(CH.),	2,3-	(CH ₂ CH ₂ -	OCH2CH2)	2,3-(CH ₂)4	4-Morobo-	lino	2 3.ICH 1	2,5,10,13,5		2,3-(CH ₂) ₄	3,4-(CH ₂) ₃		3,4-	(CH ₂ CH ₂ -	
æ.	Me	Me	Me	Ξ	H	I	I			I	Ξ		I			I	Ξ		Ξ		-
æ	Me	Me	Me	Me	Ēŧ	٩	n-Bu			t-Bu	S		NMe	7		СООМе	COMe		CH ₂ Ph		_
	Ξ	Ŧ	I	NH2	СН2С=СН	CH ₂ CN	СНО			COOMe	CH,C.C.	CF.	COCH,	2		CO-c-Pr	CH ₂ NM _{B2}		CH2CH2-	NMe ₂	-
<u>*</u>	Ξ	Ξ	I	I	I	Me	Et			c-Pr	Morpholi-	9	NH,		1	M8 ₂	I		Me		_
E	Ξ	I	I	I	Me	Me	Me			Me	Me		Me			Me	Me e		Me	=	
ICA-R-Jm	CMe ₂	CMe ₂	Cyclopentylen	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -CH ₂	CH ₂			CH ₂	CH ₂		CH ₂	•	CUMP. CUMP.		CH2		<u>ਦ</u>		
-	Me	Me	Me	C⊞CMe	SCN	CN	CONH-Me		$\overline{}$	CH-Me	NO ₂		CH ₂ OMe		440		•		SOMe		-
<u>:</u>	123	124	125	126	127	128	129		\rightarrow		<u> </u>		132		133		134	_	135		-

130 So ₂ Me CH ₂ Me Et CH ₂ · CH CH ₃ · CH 3.4·(CH ₂) ₄ CHCM CHMe 13.4·(CH ₂) ₄ CHCM CHMe 13.4·(CH ₂) ₄ CHCM CHMe 13.4·(CH ₂) ₄ CHCM CHMe 13.6·(CH ₂) ₄ CHCM CHMe 13.6·(CH ₂) ₄ CHCM CHMe 13.6·(CH ₂) ₄ CHCMe 14.6·(CH ₂) ₄ CH ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₃ CH ₂ CH ₃	ž	R1	(CR ² R ³) _m	R ⁴	R5	R ⁶	R ⁷	R ⁸	(R ⁹) _n	×	\	G	
F CH2 Me CPT CH2CH2- Et H 4-CH2Ph CH2 OCH2Ph CH2 CH2CH2- Et H 4-CH2Ph CH2 OCH2Ph CH2 CH2CH2- H H 4-CH2Ph CHMe OCOPh CH2 CH2 CH2- H H 4-CD0Me S OCOPh CH2 Me CH2CH2- CH2 H 4-CD0Me S OCOPh CH2 Me CH2CM2- CH2- H 4-CD0Me S S-CH- Me Me CH2CM2- CH3 H 4-CD0Me S S-CH- CH2 Me Me CH2CM2- CH3 H 4-CD0Me S S-CH- CH2 Me Me CH2CM2- H 4-CD0Me S O-(4+F-Ph) CH2 Me CH2CM2- CH3 H 4-CD0Me S O-(4+F-Ph) CH2 Me CH2 CH3	136		GH2	Me	Et	CH ₂ -	CH=CH-	I	3,4-(CH2)4	CHCN	CHMe		\top
F CH₂ Me CH₂CH₂· Et H 4-CH₂Ph CH₂ OCH₂Ph CH₂ Me Morpholi- CH₂C=C- H H 4-CH₂Ph CHIMe OCOPh CH₂ CH₂ CH₂ CH₂ H H 4-COOMe S OCOPh CH₂ CH₂ CH₂ CH₂ H 4-COOMe S OSO₂O-Me CH₂ Me Me CH₂CH₂- CM H 2.3,4,5-Me₄ O S-CH- CH₂ Me H CH₂CH₂- H 2.3,4,5-Me₄ O NMePh Me H CH₂CH₂- H 4-OCF₃- O O-(4-F-Ph) CH₂ Me CH₂-(H₂-F- CH₃- H 4-OCF₃- O O-(4-F-Ph) CH₂ Me CH₂-(H₂-F- SCN Me 3-t-Bu O O-(4-F-Ph) CH₂- Me CH₂-(H₂-F- SCN Me 3-t-Bu O O-(4-F-Ph) CH₂						piperidin	£						
OCH2Ph CH2 Me Morpholi- CH2C=C- H H 3-OPh CHMe OCOPh CH2 Me NMe2 CH2CM- H 4-COOMe S OCOPh CH2 Me NMe2 CH2CM- CH = CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CM- CM = CH3 M 4-COOMe S S-CH- CH2 Me H CH2CM- H 4-COOMe S NMePh CH2 Me CH2Ph CH2CM- H 4-COOMe S O-(4+F-Ph) CH2 Me CH2Ph CH2CM- H 4-COOMe S O-(4+F-Ph) CH2 Me CH2CM- CH3 H 4-COOMe S O-(4+F-Ph) CH2 Me CH2CM- CH3 H 4-COOMe S O-(4+F-Ph) CH2 Me CH2-(4+F- SCN Me 3-CH3- O O-(4-F-Ph)	137		CH ₂	Me	c-Pr	CH2CH2-	Ē	I	4-CH ₂ Ph	CH ₂	д,		T
OCH2Ph CH2 Me Morpholi- CH2C=C- H H H GHMe OCOPh CH2 Me NMe2 CH2COO- CH=CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2- CN H 2.3.4,5-Me4 O S-CH- CH2 Me H CH2CH2- CN H 2.3.4,5-Me4 O NMePh Me H CH2CH2- CN H 2.3.4,5-Me4 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-COCF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-COCF3- O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2-CH2- Me A-COCF3- O ONMe2 CH2 Me CH2-CH2- Me A-COCF3- O ONMe2 CH2 Me CH2-CH2- Me A-CB3- O ONMe2 CH2 Me CH2-CH2- Me						piperidin							
OCOPh CH2 CH2CH- H 4-COOMe S OCOPh CH2 CH2COO- CH=CH- H 4-COOMe S OSO2O-Me CH2 Me Mme CH2CH2- CM H 2.3.4.5-Me4 O S-CH- Me H CH2CH2- CM H 2.3.4.5-Me4 O NMePh Me H CH2CH2- H 3.5-ICF3/2 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-OCF3 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-OCF3 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2- H 4-OCF3 O OFT CH2 CH2 CH3 Me CH2-CH2- H 4-OCF3 O ONMe2 CH2 CH2 CH2-CH2- CH3 H 4-OCF3 O ONMe2 CH2 CH2 CH2-CH3 CH3-CH3 CH3-CH3 O ONMe2 </td <td>138</td> <td></td> <td>CH₂</td> <td>Me</td> <td>Morpholi-</td> <td>CH2C≖C-</td> <td>I</td> <td>Ξ</td> <td>3-0Ph</td> <td>CHMe</td> <td>CHMe</td> <td></td> <td>T</td>	138		CH ₂	Me	Morpholi-	CH2C≖C-	I	Ξ	3-0Ph	CHMe	CHMe		T
OCOPh CH2 Me NMe2 CH2COO- CH=CH+ H 4-CDOMe S OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2- CN H 2,3,4,5-Me4 O S-CH+ CH2 Me H CH2CH2- H 2,3,4,5-Me4 O NMePh CH2 Me H CH2Ph CH2CH2- H 3,5-(CF3)2 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2Ph CH2CH2- H 4-OCF3 O OPr CH2 Me Et CH2CH2-Ph H 4-OCF3 O ONMe2 CH2 Me CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O NMe2-CO- CH2 CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2-CO- CH2 CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O CH2 CH2 CH2					2	CH ₂ .							
OCOP ^h CH ₂ Me NMe ₂ CH ₂ COO· CH=CH· H 4-COOMe S OSO ₂ O-Me CH ₂ Me NMe ₂ CH ₂ CH ₂ · CN H 2,3,4,5·Me ₄ O S·CH· CH ₂ Me H CH ₂ CH ₂ · H 2,3,4,5·Me ₄ O O·(4·F·Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ · H 4.OCF ₃ O O·(4·F·Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ · CH=CH· H 4.OCF ₃ O O·(4·F·Ph) CH ₂ Me CH ₂ (4·F· SCN Me 3·t·Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C·Pr CH ₂ ·(4·F· SCN Me 3·t·Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C·Pr CH ₂ ·(4·F· SCN Me 3·t·Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C·Pr CH ₃ ·(4·F· CH ₂ ·CH ₃ N A·t·Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C·Pr CH ₃ ·(4·						piperidin							
OSO2O-Me CH2 Me NMe2 CH2CH2 CN H 2,3,4,5-Me4 O S-CH- CH2 Me H CH2CH2 H 3,5-(CF3)2 O NMePh CH2 Me H CH2CH2Ph CH2CH2Ph H 3,5-(CF3)2 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2Ph CH=CH H 4-OCF3 O OPr CH2 Me CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me C-Pr CH=CH- CH2-CN Me 3-t-Bu O NMe-CO- CH2 Me C-Pr CH=CH- CH2-CN Me 3-t-Bu O NMe-CO- CH2 Me C-Pr CH2-CH2 H Pr 4-t-Bu O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2-CH2 H Pr 4-t-Bu O Me Me Morpholi- CH2-CH2 H Pr 4-t	139		CH ₂	Me	NMe ₂	СН2СОО-	CH=CH-	I	4-C00Me	S	NMe		T
OSO ₂ O-Me CH ₂ CH ₂ CH ₂ CN H 2,3,4,5-Me ₄ O S-CH CH ₂ Me H CH ₂ Ph CH ₂ CH ₂ H 3,5-ICF ₃) ₂ O NMePh CH ₂ Me Me CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- H 4-OCF ₃ O OPr CH ₂ Me Et CH ₂ (4-F- SCN Me 3·t-Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me c-Pr CH=CH- CH ₂ CN Et 3·t-Bu O NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4·t-Bu O Me Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4·t-Bu O						Me	£						
S-CH CH2 Me H CH2Ph CH2CH2- H 3.5-(F3)2 O NMePh CH2-Fh1 CH2 CH2CH2Ph CH=CH H 4-OCF3 O O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2Ph CH=CH H 4-OCF3 O OPr CH2 Me Et CH2-(4-F SCN Me 3-t-Bu O ONM6-2 CH2 Me C-Pr CH=CH CH2CN Et 3-c-Bu O NMe-CO CH2 Me Morpholi CH2 H Pr 4-t-Bu O Me morpholin CH2 H Pr 4-t-Bu O	140		CH ₂	Me	NMe ₂	CH2CH2-	S	I	2,3,4,5-Me ₄	0	NEt		T
S-CH- CH ₂ Me H CH ₂ Ph CH ₂ CH ₂ H 3,5-(CF ₃) ₂ O NMePh CH ₂ CH-Ph CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- H 4-OCF ₃ O O-(4-F-Ph) CH ₂ Me CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH- H 4-OCF ₃ O OPr CH ₂ Me CH ₂ (4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me C-Pr CH=CH- CH ₂ CN Et 3-t-Bu O NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin H Pr 4-t-Bu O						NO ₂							
NMePh NMe Ph NMe Ph NMe Ph CH ₂ CH ₂ Ph CH=CH-CH-Ph H 4-OCF ₃ O OPr CH ₂ Me Et CH ₂ (4-F-CH ₂ Ph SCN Me 3-t-Bu O ONMe ₂ CH ₂ Me c-Pr CH ₂ CH CH ₂ CN Et 3-0CF ₃ O NMe-CO-CH ₂ Me Morpholi-CH ₃ CH ₃ H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin H Pr 4-t-Bu O	141	S-CH-	cH ₂	Me	I	CH ₂ Ph	CH2CH2-	Ξ	3,5-(CF ₃) ₂	0	¥		Т
O-(4-F-Ph) CH2 Me CH2CH2Ph CH=CH- H 4-OCF3 O OPr CH2 Me Et CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-c-Bu O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH3 H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin CH2- H Pr 4-t-Bu O		NMePh					NMe ₂		!				
OPr CH2 Me Et CH2·(4-F- SCN Me 3·t-Bu O ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3·OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2- H Pr 4·t-Bu O Me no morpholin CH2- H Pr 4·t-Bu O	142		CH ₂	Me	Ме	CH2CH2Ph	CH=CH-	I	4-0CF ₃	0	0		
OPr CH2 Me Et CH2-(4-F- SCN Me 3-t-Bu O ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2- H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin CH2- H Pr 4-t-Bu O							CH3						
ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2 H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin morpholin O O O	143		CH ₂	Me	Et	CH ₂ -(4-F-	SCN	Me	3-t-Bu	0	0		T
ONMe2 CH2 Me c-Pr CH=CH- CH2CN Et 3-OCF3 O NMe-CO- CH2 Me Morpholi- CH2- H Pr 4-t-Bu O Me no morpholin morpholin O Morpholin O		-	,			P.							
NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O morpholin	144	ONMe ₂	CH ₂	Me	c-Pr	ਲ=ਲ-	CH ₂ CN	THE STATE OF	3-0CF,	0	0		
NMe-CO- CH ₂ Me Morpholi- CH ₂ - H Pr 4-t-Bu O						G.))				
no morpholin	145	NMe-CO-	CH ₂	Me		CH ₂ -	I	٦	4-t-Bu	0	0		\top
		Ž		*	2	morpholin					ı		

II	В	(CR ² R ³) _m	R4	RS	R ⁶	R7	R ⁸	(R ⁹),	×	٨	E	[
146	CH ₂ -t-Bu	CH ₂	Me	NH ₂	NHMe	CH2C≡C-	n-Bu	4-CH ₂ OMe	0	0		
						CH ₂ -						
						piperidin	_					
_	i-Pr	CH ₂	Me	NMe ₂	NMe ₂	CH ₂ OMe	t-Bu	4-CH ₂ CF ₃	0	0		T -
148	NHCOPh	CH ₂	Me	I	СН2СН2ОН	Me	S	4-COMe	CH ₂	0		7
149	NMePh	сн ₂	№	Me	CH2CH20-	ŭ	NMe ₂	4-C00Me	CMe ₂	0		
					Me							
150	NHCOPh	CH ₂	₹ e		CH ₂ CH ₂ O- Et	Pr	СООМе	4-CONMe ₂	0	CM ₆₂		
	C≅CMe	снсғ	M e	c-Pr	CH ₂ CH ₂ O-	n-Bu	СОМе	4-CONHMe	N-CH ₂ - C■CH	0		 _
152	SCN	-등	Me	Morpholi-	CH2CH2-	t-Bu	CH ₂ Ph	4-CONH,	N-COCH,	0		
		CF = CHMe		no	NHPh			•	,			
	N.	CHMe	CF ₃	NH ₂	CH ₂ CH ₂ -	S	CH=CH- CH3	4-Me	0	СН 2		
154	CONH-Me	CMeEt	CF ₂ CI	NM8 ₂	CH ₂ CH ₂ O- 4-F-Ph	NMe ₂	ជា	4-Me, 3-t-Bu CH ₂		CMe ₂		
155	CF = CH-Me		CF ₂ CF ₃	I	CH2CH2O-	СООМе	I		CMe ₂	0		
					3,5-Me ₂ -Ph			3-0CF ₃				
_	NO ₂	CMeEt	CH2CF3	₩	CH ₂ CH ₂ O-	e WOO	÷	3-Me, 4-t-Bu	0	N-Bu		-
					2,3-Cl ₂ -Ph	,	CH3					

	T							T		T		T			T			Τ		
Fp.						_		\perp												
<u> </u>	N-Et			0		S		so,	•	0		SO			GH,	•		CHMe		
×	CHMe		-	윤	·	0		S		С Н ,		CHMe			CH-CH ₂ -	C.CH		сн-сн	COOMe	
(R ⁹),	3∙Me,	4-CH ₂ OMe		3-Me,	4-CH ₂ CF ₃	3-Me,	4-COMe	3-Me,	4-C00Me	3-Me,	4-CONMe ₂	3-Me,	4-CONHMe		3-Me,	4-CONH2		4,5-Me ₂ ,	3-t-Bu	
H ⁸	S			CH2CH2-	NMe ₂	CH=CH-	G.	SCN		CH ₂ CN		Ξ			CH ₂ C = C- 3-Me,	CH ₂ .	piperidin	CH ₂ OMe		
R7	CH ₂ Ph			-но=но	£	댐	_	Ŧ		CH=CH-	£	8			CH2CH2-	NMe ₂		CH=CH-	ਜੁ	
R ⁶	CH2CH2O-	4-CONH ₂ -	Ph	CH ₂ CH ₂ -	СООМе	CH2CH2-	CONH2	CH2CH2-	CONMe ₂	CH2CH2-	2-thiophen	CH2CH2-	(3-Br-2-	thiophen)	CH2CH2-	2-pyridin		CH2CH2-	(3-C)-	2-pyridin)
R5	£			c-Pr		Morpholi-	0	NH ₂		NMe ₂	_	H			Me	•		Et		
R4	ᄄ			Pr		Bu	·	£		4-F-Ph		I			I			Ме		
(CR ² R³) _m	СНОРҺ			CH-SOMe		CH-COMe	-	C(Me)OMe		CHCECMe		CHC=CH			CHCF = CFCI			CH-NMeEt		
٦¹	CH ₂ OMe			OPh		OCH ₂ .	C=CH	SOMe		SO ₂ Me		L.			OCH ₂ Ph			OCOPh		
Ž.	157			158		159		160		161		162			163			164	· <u> </u>	

(CR ² R³) _m R ⁴ R ⁵	R ⁴ R ⁵	RS		Re		R ⁷	R ⁸	(R ⁹),	×	X	-Бр.
050 ₂ -0- CH- Bu c-Pr	<u>a</u>		<u>د ۹</u>		CH2CH2-	SCN	Me	4,5-Me ₂ ,	ccı ₂	CH ₂	
NMeCH ₂ O-Me	-Me				(3-C1-5-			3-0CF ₃			
		voon († 144			F ₃ C-						
					2-pyridin)						
S-CHMe-Ph CMe-COOMe CF ₃ Morpholi-	CF ₃		Morph		Me	CH2CN	ŭ	3,5-Me ₂ ,	CF ₂	CHMe	
00	Ou	Ou	<u>و</u>					4-t-Bu			
O-(4-F-Ph) CH-CONHMe CF2CI NH2	CF ₂ CI		NH2		Bu	Ŧ	I	3,5-Me ₂ ,	CFCI	CH ₂	
								4-CH ₂ 0Me			
CH-NHCOPh CF ₂ CF ₃ NMe ₂	CF ₂ CF ₃		NM ₆₂		j-Pr	CH2C≖C-	Ι	3,5-Me ₂ ,	CHCN	CHMe	
· · ·						CH ₂ .		4-CH ₂ CF ₃			
		-				piperidin					
CMe-NH-t-Bu CH ₂ CF ₃ H	CH ₂ CF ₃	_	I		CH ₂ -(4-Me-	CH ₂ OMe	I	3,5-Me ₂ ,	공 공	CH ₂	
					Ph)			4-COMe	-		
NMe-CO- CH-OSO ₂ Me Et Me	ŭ		Me		NH ₂	CH ₂ OCH ₂	CH ₂	3,5-Me ₂ ,	CHMe	CHMe	
								4-C00Me		***	
CH ₂ -t-Bu CHCOPh Pr Et			T.		CH ₂ C≡CH	CH2CH2CH2CH2	CH2CH2	3,5-Me ₂ ,	S	NMe	
								4-CONMe ₂		·	
CHSMe Bu c-Pr			c-Pr		CH ₂ CN	CH2CH2CH2	2CH2	3,5-Me ₂ ,	0	NEt	
	·	· ·						4-CONHMe			
NHCOPh Ph Morpholi-			Morp		СНО	CH2SCH2	CH ₂	3,5-Me ₂ ,	0	¥.	
OU.	င္	ou	2			***		4-CONH ₂	-		

	T	T	T	T		T		T		Т		T		T			7		一	
<u>ق</u>																				
٨	0	0	0	0)	0) 	c)	0		0)	CMa	7		0		0	
×	0	0	0	0		0		0		₽,	•	CMe,	7	0			N-CH3-	, H2 = 2	N-COCH ₃	,
(R ⁹),	3,5-(OMe) ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me,		3,5-Me,	•	3,5-Me,	•	3,5-Me ₂	1	3,5-Me,	•	3,5-Me,	•		3,5-Me ₂		2,4-M ₈₂	
88	CH2NMe-CH2	CH2N(CH2Ph)-CH2	CH ₂ CHMe-CH ₂	CH2-CHNO2-CH2	•	CH = CH-CH2CH2	1	CH2CH2-CH=CH		CH2CH = CHCH2		CONMe-CO		сн,осн,			CH2CH2CH2		CH2CH2CH2	
R,	Ō	_	ਲ	공		-		-		G.	<u> </u>			_			CH ₂ (ਲ	
Re	COOMe	CH2C=CF3	СОСН3	CO-c-Pr		CH ₂ NMe ₂		CH2CH2-	NMe ₂	CH ₂ -	piperidin	CH2CH2-	piperidin	CH2C=C-	CH ₂ -	piperidin	CH2C00-	Me	CH ² CH ² -	N02
RS	NH ₂	NMe ₂	NHPh	NHCH ₂ -	CH ₂ OMe	CH2CH2-	OMe	CH2CH2-	SMe	COMe		COPh		I			Me		Ęŧ	
R ⁴	4-F-Ph	I	I	Me		Βυ		CF ₃		CF ₂ CI		CF ₂ CF ₃		CH ₂ CF ₃			Et		à	
(CR ² R ³) _m	CH-CH ₂ OMe	CMe-c-Pr	CMe-SO ₂ OMe	CH ₂		CH ₂		CH ₂		CH ₂		CH ₂		CH ₂			CH ₂		<u>-</u> ಕ	
	NMePh	NHCOPh	NH-c-Pr	CHCMe		SCN		CN		CONH-Me		CF = CH-Me		NO ₂			CH ₂ OMe			
ž	174	175	176	17.7		178		179		180		181		182			183	_	184	-

	T		T		T	7	T		T		T	T	T	T		T		T		T	
بق																					
٨	ਤੇ,	٧	CMe,	•	0		NPr		N(O)		0	0	0	0	ı	0		CH,	1	CHMe	
×	0		д ,	1	CMe,	;	0		CHMe		CH ₂ O	0	S	£,	ŧ	CHMe	:	CH(CH ₂ -	C=CH)	CH(CH ₂ -	COOMe)
(R ⁹) _n	2,4-Me,	•	2,4-Me ₂		2,4-Me ₂	1	2,4-Me ₂	ı	2,4-Me ₂	ı	2,4-Me ₂	2,4-Me ₂	2,4-Me ₂	2,4-Me,	•	3,4-(OMe),	1	3,4-(OMe) ₂		3,4-(OMe) ₂	
R8	сн28сн2	,	CH ₂ NMe-CH ₂		CH2N(CH2Ph)-CH2		CH2CHMeCH2		CH ₂ CH(NH ₂)CH ₂		CH = CH-CH ₂ CH ₂					Ē		Me		JB B	
R7	CH ₂ S	•	CH2NN		CH ₂ N(CH		CH2CH		CH ₂ CH(r		CH = CH-	CH ₂ CH ₂ -CH = CH	CH2CH = CHCH2	CONMe-CO		I		Ξ	· · · · ·	Ι	-
Rб	CH ₂ Ph		CH2CH2Ph		CH ₂ -(4-	F-Ph)	CH=CH·	CH ₃	CH ₂ -	morpholin	NHMe	NMe ₂	СН2СН2ОН	CH2CH2O-	Me	CH2CH20-	ᄄ	CH2CH20-	Ph	CH ₂ CH ₂ -	AT P
RS	c-Pr		Morpholi-	2	NH ₂		NMe ₂		Н		Me	Eŧ	c-Pr	Morpholi-	2	NH ₂		NMe ₂		I	
R ⁴	Bu		Æ		4-F-Ph		н		I		Me	Bu	CF ₃	CF ₂ Cl		CF ₂ CF ₃		CH ₂ CF ₃		Ē	
(CR ² R ³) _m	CH ₂		CH ₂		CH ₂		CH ₂		CH ₂		CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH2CH2		CH ₂		CH ₂ CH ₂ CH ₂		CH ₂	`
R¹	- ^z нэо	С≖СН	SOMe		SO ₂ Me		u.		OCH ₂ Ph		осорь	OSO ₂ O-Me	SCHMe-Ph	0-(4-	F-Ph)	0		ONMe ₂		NMeCO-Me	
ž Ž	185		186		187		188		189		190	191	192	193		194		195		196	

L	ľ										
ž	Α,	(CR ² R ³) _m	E	E.	Re	R ⁷	R ₈	(R ⁹),	×	<u>></u>	ē
197	CH ₂ -t-Bu	CH ₂	ئد	Me	CH2CH2-	Ξ	S	3-OMe,	CCI,	કેં	
					NMePh			5-Me	•	•	
198	-Pr	CH ₂	Bu	ĬĮ.	CH2CH20-	Ξ	SCN	3-0Me,	Ŗ,	CHMe	
,	P				(4-F-Ph)			5-Me	•		
199	NHCOPh	CH ₂	Æ	c-Pr	CH2CH2O-	I	NMe ₂	3-SMe, 5-Me	CFC	ੁ ਜ	
<i>: ·</i> ·					(3,5-					•	
					Me ₂ -Ph)						
200	NMePh	CH ₂	4-F-Ph	Morpholi-	CH2CH2O-	Ξ	CH ₂ NMe ₂	CH ₂ NMe ₂ 3-SO ₂ Me,	CHCN	CHMe	
				2	(2,3-Cl ₂ -			5-Me			
					æ						
201	NHCOPh	CH ₂	I	NH ₂	CH2CH2O-	I	CH ₂ NHPh	3-SMe, 5-CI	हैं	Ŗ,	
					(4-CONH ₂ -				ı	•	
					F						
202	CECMe	CHCF3	I	NMe ₂	CH2CH2-	Ŧ	CHMe-	3-SMe,	CHMe	CHMe	
					COOMe		NM ₈₂				
203	SCN	CHCF = CHMe	Me	H	CH2CH2.	Ξ	COPh	3-CF,CF,H	S	NMe	
					CONH ₂			•	_		
204	CN	CHMe	Bo Bo	Me	CH2CH2-	I	I	3-CF,CF,H,	0	NF	
					CONMe2						
205	CONH-Me	CMeEt	I	Et	CH2CH2-	I	COMe	3-CF ₃ , 5-Me	0	¥	
					2-thiophen			<u> </u>			

Fp.							-													
×	0	-	•	0		0		_	0		•		0		0		CH ₂	CMe,		
(R ⁹),	3-CF ₃ , 5-Me			3-SMe, 5-F		3-SMe, 0	5-NO ₂	1	3-CF2CF2H 0	1			3-CF2CF2H, 0	5-ОМе	3-CF ₃ , 0	5-ОМе	3-CF ₃ , 5-Me			
R ⁸	ŭ			2.	Pyridinyl	2-Thio-	phenyl		I				I		Me		Ē	å		
R7	I			Ξ		Ŧ			I	-			Ξ	_	Ι		Ξ	Ξ		
Re	CH2CH2-	(3-Br-	2-thiophen)	CH2CH2-	2-pyridin	CH ₂ CH ₂ -(3-	CI-2-	pyridin)	CH2CH2-	(3-C1-5-	F ₃ C-2.	pyridin)	Me		Bu.		-Pr	CH ₂ -(4-Me-	æ	
R5	c-Pr			Morpholi-	2	NH ₂			NMe ₂				I		Me		ш ш	c-Pr		
R ⁴	Ξ			Ŧ		I			I				I		I		I	H		
(CR ² R ³) _m	CF = CH-Me Cyclobutylen			CMeEt		СНОРҺ			CHSOMe				снсоме		CMe-OMe		CHC = CMe	HO ■ OHO		
R.	CF = CH-Me			NO ₂		CH ₂ OMe								CECH	SOMe		SO ₂ Me	u.		
ž	206			207		208			209 OPh				210		211		212	213		

	T		T		T		T		T		T		$\overline{}$			_	_			-	
ē										•		-									
<u> </u>	0		0		CH ₂	ı	CMe ₂		0		NMe		NCH,	•		0		3	7	0	
×	NCH ₂ -	CCH	N-COCH ₃	,	0		CH ₂		CMe2	1	0		CHMe			0		मु		ਲੇ,	
(R ⁹) _n	4-0CH ₂ -	C≡CPh	4-0CH ₂ -	C=CCH ₃	3,5-Me ₂ ,	4-CS-SMe	3,5-Me ₂ ,	4-CS-OMe	3,5-Me ₂ ,		3,5-Me ₂ ,	4-S0 ₂ Me	3,4-Me ₂ ,	5-SO ₃ Me	,	3,5-Me2,	4-0Ph	3,5-Me _{3,}		3,5-Me ₂ ,	•
R ⁸	Ξ		Ŧ		Me		Ē		Pr		26		Ξ			I		Me		THE STATE OF THE S	
R ⁷	Ξ		π		I		I		Ι		Me		Ę			P.		B		Ξ	
Re	CH2CH2-(4-	Me-Ph)	CH ₂ CF ₃		CF ₂ CF ₂ H		-S-cci ₃		COPh		COCH ₂ Ph		CH ₂ CH ₂ 0-	(4-CONH ₂ -	£	CH2CH2-	СООМе	CH2CH2-	CONH2	CH2CH2-	2-thiophen
RS	NH ₂		NMe ₂		I		Me		Et		c-Pr		Morpholi-	2		NH ₂		NM ₈₂		I	
₽4	Me		H		I		I		I		I		I			I		I		ı	
(CR ² R ³) _m	CHNMeEt		CH-NMe-	CH ₂ O-Me	CMe-COOMe		CH-CONHM ₆		CH-NHCOPh		CMe-NH-t-Bu		CH-0S0 ₂ Me			CH-COPh		CH-SMe		CH-OPh	
٦	ОСОРЬ		0S0 ₂ 0-Me		SCHMe-Ph	$\neg \uparrow$	0-(4-F-Ph)		OWe O		ONMe ₂		NMeCO-Me (CH ₂ -t-Bu		i-Pr		NHCOPh	
ž	215		216	-	217		218		219		220		221			222 (223		224 N	

Z.	R¹	(CR ² R³) _m	R4	R ⁵	R ⁶	R7	R ⁸	(R ⁹),	×	<u> </u>	Fp.	<u></u>
225	NMePh	CH-CH ₂ OMe	I	Me	CH2CH2-	I	ď	3,5-Me ₂ ,	ਜ਼ੇ,	0		
					2-thiophen			4-C = CMe	•			
226	NHCOPh	CMe-c-Pr	I	Eŧ	CH2CH2.	Me	26	3,5-	CMeCOO-	GH,		
					(3-Br-2-			(C≡CH) ₂	Me	•		
1					thiophen)			•			_	
227	NH-c-Pr	CMeSO ₂ OMe	I	c-Pr	CH2CH2-	E E	S	3,5-	CHCONH-	CMe,		
T					2-pyridin			(C≡CMe) ₂		•		
228	LL.	Cyclobutylen	I	Morpholi-	CH2CH2-(3-	å	SCN	2-CH ₂ -t-Bu	CHNHCO- 0	0		
				uo	Cl-pyridin)			I	£			
229	5	CMeEt	H	NH2	CH ₂ CH ₂ -(3-	Bu.	NMe ₂	3-i-Pr	CMeNH-t-	0		
					CI-5-F3C-2-				Br.			
					pyridin)							
230	Br	СНОРҺ	Ŧ	NMe ₂	Ме	Ξ	CH ₂ NM ₆₂	CH ₂ NMe ₂ 4-NHCOPh	CHOSO ₂ -	CH ₂		
									∑	1		
231	CF ₃	СНЅОМе	Ξ	NHPh	Bu .	£	댐	4-NMePh	CHCOPh	CMe2		
232	CF ₂ CF ₂ H	СНСОМе	Bu	NHCH ₂ -	i-Pr	Me	Pr	4-NHCOPh	CHSMe	0		
				CH ₂ OMe								
233	CO-c-Pr	СМеОМе	c-Pr	CH2CH2-	CH ₂ -4-Me-	E E	Bu	3-NH-c-Pr	CHOPh	c		
				ОМе	£)		
234	CONMe ₂	CHC°CM®	Et	CH2CH2-	CH2CH2-4-	F.	S	3,5-F	СНСН,О-	ਜ਼ੇ,		
				SMe	t-Bu-Ph					7		
												_

Ž.	R³	(CR ² R³) _m	R4	Я ⁵	R ⁶	R7	R ⁸	(R³),	×	٨	Fp.
235	NMe-c-Pr	CHC#CH	H	СОМе	CH ₂ CH ₂ -4- Me-Ph	B N	SCN	4-CH ₂ CH ₂ -	CMe-c-Pr	CMe ₂	
236	NH-c-Pr	CHCF = CFCI	x	COPh	CH ₂ CF ₃	Ξ	NMe ₂	4-CH ₂ CH ₂ -	CMeSO ₂ .	0	
237	S-c-Pr	CHNMeEt	Piperidino	I	CF2CF2H	I	CH ₂ NMe ₂	CH ₂ NMe ₂ 4-CH ₂ CH ₂ -	OMe CH ₂	0	
238	CH = CMe-	CHNMeCH ₂ -	Morpho-	Me	-S-CCI	Me	4	4-CH ₂ CH ₂ -	CH ₂	0	
239	CF = CF-Me	СМеСООМе	СН2СН2СН2СН2		COPh	Et	4-F-Ph	3-(CH ₂ CH ₂ - 2-thiophen)	CMeCOO-	0	
240	C(Me) = CMe ₂	СНСОИНМе	CH2CH2	CH2CH2CH2	COCH ₂ Ph	g.	2,4-Cl ₂ -Ph	2,4-Cl ₂ -Ph 4-[CH ₂ CH ₂ - (3-Br-2- thiophen)]	-HNO	0	
241	SH	СНИНСОРЬ	СН2СН2СН2	-	CH ₂ -c-Pr	BG	ŭ	3-(CH ₂ CH ₂ - 2-pyridin)	CHNHCO-	0	
	НО	CMeNH-t-Bu	CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂		NMe ₂	I	å	3-(CH ₂ CH ₂ - 2-pyridin)	CMeNH-t- Bu	0	
243	нооэ	CH0S0 ₂ Me	CH ₂ CH ₂ C	CH ₂ CH ₂ CH ₂	CH ₂ CH ₂ -	I	26	4-(CH ₂ CH ₂ - 2-(3-Cl-5- CF ₃ -2-	CHOSO ₂ -	CM ₈ 2	
\neg								pyridin)]			

		-	T		T	T		T	_	-	T		T -		_		T	_	
Fp.							~			···	71-73		171-173				61-63		
*	0		0		CH ₂	CMe ₂	ı	0	N-Bu	,	0		0		0		0	S	
×	CHCOPh		CHSMe		СНОРЬ	CHCH ₂ 0-		CMe-c-Pr	0		0		CH ₂		0		0	0	
(R ⁹) _n	2-Me		3-Bu, 4-Me,	5-F	3,5-(i-Pr) ₂	3,5-Me ₂		3,5-Me ₂	3,5-Me ₂		Me ₂ ,	4-CI	Me ₂ ,	4-CI	3,5-Me ₂ ,	4-CI	3,5-Me ₂	1	4-CI
R8	S		SCN		NMe ₂	CH ₂ NMe ₂		CH ₂ NHPh		NMe ₂	Ξ		I		I		I	I	
. R ⁷	₩		Ēŧ		Pr	Bu		I	I		క్		క్		క్		G ₃	GH3	
R ⁶	CH2CO-	CH ₂ NM ₆₂	COCH ₂ Ph		CH ₂ -c-Pr	NMe ₂		CH ₂ CH ₂ - NMe ₂	сн2со-	CH ₂ NMe ₂	I						I	I	
ЯS	Me		CH2CH2CH2		2CH2CH2CH2			сн, осн, сн,	2CH2CH2CH2		H		I		I		I	ī	
R4	Morpho-	lino	CH2CH2CH		CH ₂ CH ₂	CH2CH2CH2		сн2сн20	CH2CH2		I		I		<u> </u>		I	I	
(CR ² R ³),,	CHCOPh		CHSMe		СНОРҺ	CHCH ₂ 0Me		CMe-c-Pr	CMe-SO ₂ OMe		CH-CH ₃				CH ₂		CH-CH ₃	CH-CH ₃	
R¹	CONH2		NHCHO		NMe-CHO	S0 ₂ 0H		248 OSO ₂ -OMe	O-NMeEt		I				5			СН3	
Ž.	244		245		246	247		248	249		250		167		707	_	253	254 (

Ħ		1002031	104	105	92	17	9	9.1			
	ے	m'_n_n,	r.	<u>.</u>	Ŷ.	ì.	è.	(R³),	<u>×</u> _	<u>></u>	.
	<u>5</u>	CMe ₂	I	Ξ	Ξ	ਜੁ	Ŧ	3,5-Me ₂ ,	0	0	
								4-C			
	Ċ	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂	I	I	I	I	Ŧ	2,4-Me ₂	CH ₂	0	flüssig
	Ö	CH ₂	I	I	Ŧ	Ξ	Ŧ	2,4-Me ₂	CH ₂	0	flüssig
	Ö	CH ₂	I	I	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
	ਠ	СН2	I	Ξ	Ξ	Me	=	I	CH ₂	CH ₂	flüssig
	ರ	CH ₂	H	I	I	Me	Ξ	I	CH ₂	CH ₂	
	CH2	42	H	Ŧ	I	Me	I	3,5-Me ₂ ,	CH ₂	0	flüssig
	_							4·J			
	는 건		I	I	Ξ	Me	I	3,4-CI	CH ₂	0	108 -
	-										110
	품		I	I	I	Me	I	3-Me,	CH ₂	0	
ļ						-		5-iPr	,		
	СН ₂		Н	I	Ξ	Me	Ŧ	3,5-Me ₂	CH ₂	CH ₂	flüssig
	CH ₂	-	Н	H	I	Ē	I	3,5-Me ₂	GH2	CH ₂	
	CH2		I	Ι	I	i-Pr	I	3,5-Me ₂	GH ₂	ਲ,	flüssig
	CH ₂		I	I	I	Me	I	I	CH ₂	GH,	50 - 52
	CH ₂		I	I	I	ŭ	Ξ	I	GH,	G,	
	CH2		I	I	I	Me	I	2,3-Me ₂	CH ₂	. 0	flüssia
ĺ									•		•

	T		T	T		T		-T-		-									
Fp.	flūssia		fest	flüssig	fest	flüssig	55 - 60					flüssig	flüssig	flüssig	r :	flüssig	flüssia	122.	
<u>\</u>	0		0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0	0		CH ₂	0	0	
×	<u>ਉ</u>	•	CH ₂	GH ₂	GH ₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂	ਜ,	CH ₂	GH2	CH ₂	CH ₂		G ₂ ,	CH,	CH ₂	
(R ⁹) _n	2,3-Me ₂		3,5-Me	3,5-Me	3,5-Me	3-Me	3,5-Me	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-Me ₂	3,5-(OMe) ₂	3,5-(OMe) ₂	3,5-Me ₂	3-Me,	5-0Me	I	3,5-(OMe) ₂	1	
Ra	I		Me	12-CH2-	Me	I	Ξ	I	Ξ	I	F	r	I	Ξ		Ξ	Ξ	Ξ	
R ⁷	Me		Me	-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -	I	Μœ	Me	5	Me	Me	Me	Me	1 11	Me		Me	Me	2-Thienyl	4.14
Re	Ŧ		I	Ŧ	I	Ŧ	I	Ξ	I	Ξ	H	I	I	I		H	T	I	
RS	Ŧ		I	I	I	Ξ	I	I	I	I	I	I	I	I		H	I	I	
R ⁴	I		I	Н	Ŧ	I	I	I	I	I	I	I	I	Ŧ		I	ı	I	
(CR ² R ³) _m	CH2CH2CH2-	CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂	CH ₂ -CH ₂	сн ₂	сн	CH ₂			CH ₂ -CH ₂	CH ₂					
R¹	I		Me	Me	Me	Me	Me	Me	Et	i-Pr	Me	Me	Me	Me		Me	₹.	Me	
ž	270		271	272	273	274	275	276	277	278	279	280	281	282		283	284	285	

4											
Ž.	R	(CR*R*)m	.	L	۳. د	œ	æ.	(R ⁹) _n	×	\	Fp.
286 Me	Me	CH ₂	I	I	Ξ	3-Ci,	Ŧ	3,5-Me ₂	GH,	0	127.
						4-F-Ph			1		128
287	Me	CH ₂	Ŧ	I	Ξ	3-Me-Ph	Ξ	3,5-Me ₂	CH ₂	0	
288	Me	CH ₂	I	Ŧ	Ŧ	Me	I	3-8r	કે.	0	
289	Me	CH ₂	Ŧ	I	Ŧ	Me	 ±	3-CI	, E	, 0	
290 Me		CH ₂	ī	I	I	Me	Ξ	3.Et	E	0	
									7)	

- B. Formulierungsbeispi le
- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile einer Verbindung der Formel (I) und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I), 64 Gewichtsteile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gewichtsteile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat wird erhalten, indem man 20 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I) mit 6 Gew.-Teilen Alkylphenolpolyglykolether (*Triton X 207), 3 Gew.-Teilen Isotridecanolpolyglykolether (8 EO) und 71 Gew.-Teilen paraffinischem Mineralöl (Siedebereich z.B. ca. 255 bis über 277°C) mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat wird erhalten aus 15 Gew.-Teilen einer Verbindung der Formel (I), 75 Gew.-Teilen Cyclohexanon als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertes Nonylphenol als Emulgator.
- e) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird erhalten indem man 75 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I),
 - 10 " ligninsulfonsaures Calcium,
 - 5 " Natriumlaurylsulfat,
 - 3 " Polyvinylalkohol und
 - 7 " Kaolin

mischt, auf einer Stiftmühle mahlt und das Pulver in einem Wirbelbett

durch Aufsprühen von Wasser als Granulierflüssigkeit granuliert.

f) Ein in Wasser dispergierbares Granulat wird auch erhalten, indem man 25 Gewichtsteile einer Verbindung der Formel (I),

5 " 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium

2 " oleoylmethyltaurinsaures Natrium,

1 Gewichtsteil Polyvinylalkohol,

17 Gewichtsteile Calciumcarbonat und

50 Wasser

auf einer Kolloidmühle homogenisiert und vorzerkleinert, anschließend auf einer Perlmühle mahlt und die so erhaltene Suspension in einem Sprühturm mittels einer Einstoffdüse zerstäubt und trocknet.

71

C. Biologische Beispiel

1. Unkrautwirkung im Vorauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkrautpflanzen werden in Plastiktöpfen in sandiger Lehmerde ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Die in Form von benetzbaren Pulvern oder Emulsionskonzentraten formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden dann als wäßrige Suspension bzw. Emulsion mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 I/ha in unterschiedlichen Dosierungen auf die Oberfläche der Abdeckerde appliziert.

Nach der Behandlung werden die Töpfe im Gewächshaus aufgestellt und unter guten Wachstumsbedingungen für die Unkräuter gehalten. Die optische Bonitur der Pflanzen- bzw. Auflaufschäden erfolgt nach dem Auflaufen der Versuchspflanzen im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen. Wie die Testergebnisse zeigen, weisen die erfindungsgemäßen Verbindungen eine gute herbizide Vorauflaufwirksamkeit gegen ein breites Spektrum von Ungräsern und Unkräutern auf. Beispielsweise zeigen die Beispiele Nr. 1, 3, 4, 5, 6, 7, 12, 13, 19, 25, 27, 29, 32, 37, 39, 40, 49, 50, 64, 68, 73, 74, 82, 84, 85, 88, 92, 96, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 250, 251, 253, 256, 257, 259, 261, 262, 264, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 280, 281, 282, 283, 284, 285 und 286 (s. Tabelle 1) im Test sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie Sinapis alba, Chrysanthemum segetum, Avena sativa, Stellaria media, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Setaria spp., Abutilon theophrasti, Amaranthus retrofluxus und Panicum miliaceum im Vorauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0,5 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

2. Unkrautwirkung im Nachauflauf

Samen bzw. Rhizomstücke von mono- und dikotylen Unkräutern werden in Plastiktöpfen in sandigem Lehmboden ausgelegt, mit Erde abgedeckt und im

Gewächshaus unter guten Wachstumsbedingungen angezogen. Drei Wochen nach der Aussaat werden die Versuchspflanzen im Dreiblattstadium behandelt. Die als Spritzpulver bzw. als Emulsionskonzentrate formulierten erfindungsgemäßen Verbindungen werden in verschiedenen Dosierungen mit einer Wasseraufwandmenge von umgerechnet 600 bis 800 I/ha auf die grünen Pflanzenteile gesprüht und nach ca. 3 bis 4 Wochen Standzeit der Versuchspflanzen im Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen die Wirkung der Präparate optisch im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen bonitiert. Die erfindungsgemäßen Mittel weisen auch im Nachauflauf eine gute herbizide Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum wirtschaftlich wichtiger Ungräser und Unkräuter auf. Beispielsweise zeigen die Beispiele Nr. 1, 3, 4, 5, 6, 7, 12, 13, 19, 25, 27, 29, 32, 37, 39, 40, 49, 50, 64, 68, 73, 74, 82, 84, 85, 88, 92, 96, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 250, 251, 253, 256, 257, 259, 261, 264, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 280, 281, 282, 283, 284, 285 und 286 (s. Tabelle 1) im Test sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen wie Sinapis alba, Echinochloa crus-galli, Lolium multiflorum, Chrysanthemum segetum, Setaria spp., Abutilon theophrasti, Amaranthus retroflexus, Panicum miliaceum und Avena sativa im Nachauflaufverfahren bei einer Aufwandmenge von 0,5 kg und weniger Aktivsubstanz pro Hektar.

3. Wirkung auf Schadpflanzen in Reis

Verpflanzter und gesäter Reis sowie typische Reisunkräuter werden im Gewächshaus bis zum Dreiblattstadium (Echinochloa 1,5-Blatt) unter Paddyreis-Bedingungen (Anstauhöhe des Wassers: 2 - 3 cm) in geschlossenen Plastiktöpfen angezogen. Danach erfolgt die Behandlung mit den erfindungsgemäßen Verbindungen. Hierzu werden die formulierten Wirkstoffe in Wasser suspendiert, gelöst bzw. emulgiert und mittels Gießapplikation in das Anstauwasser der Test-pflanzen in unterschiedlichen Dosierungen ausgebracht. Nach der so durchgeführten Behandlung werden die Versuchspflanzen im

PCT/EP96/02479

Gewächshaus unter optimalen Wachstumsbedingungen aufgestellt und während der gesamten Versuchszeit so gehalten.

Etwa drei Wochen nach der Applikation erfolgt die Auswertung mittels optischer Bonitur der Pflanzenschäden im Vergleich zu unbehandelten Kontrollen, wobei beispielsweise die Verbindungen Nr. 1, 3, 4, 5, 6, 7, 12, 13, 19, 25, 27, 29, 32, 37, 39, 40, 49, 50, 64, 68, 73, 74, 82, 84, 85, 88, 92, 96, 101, 102, 103, 104, 106, 107, 108, 109, 110, 250, 251, 253, 256, 257, 259, 261, 262, 264, 266, 267, 269, 270, 271, 272, 273, 274, 275, 280, 281, 282, 283, 284, 285 und 286 (s. Tab. 1) sehr gute herbizide Wirkung gegen Schadpflanzen zeigen, die typisch für Reiskulturen sind, wie z.B. Cyperus monti, Echinochloa crus-galli, Eleocharis acicularis und Sagittaria pygmaea.

4. Kulturpflanzenverträglichkeit

In weiteren Versuchen im Gewächshaus werden Samen einer größeren Anzahl von Kulturpflanzen und Unkräutern in sandigem Lehmboden ausgelegt und mit Erde abgedeckt. Ein Teil der Töpfe wird sofort wie unter Abschnitt 1 beschrieben behandelt, die übrigen im Gewächshaus aufgestellt, bis die Pflanzen zwei bis drei echte Blätter entwickelt haben und dann wie unter Abschnitt 2 beschrieben mit den erfindungsgemäßen Substanzen der Formel (I) in unterschiedlichen Dosierungen besprüht. Vier bis fünf Wochen nach der Applikation und Standzeit im Gewächshaus wird mittels optischer Bonitur festgestellt, daß die erfindungsgemäßen Verbindungen zweikeimblättrige Kulturen wie z.B. Soja, Baumwolle, Raps, Zuckerrüben und Kartoffeln im Vorund Nachauflaufverfahren selbst bei hohen Wirkstoffdosierungen ungeschädigt lassen. Einige Substanzen schonen darüber hinaus auch Gramineen-Kulturen wie z.B. Gerste, Weizen, Roggen, Sorghum-Hirsen, Mais oder Reis. Die Verbindungen der Formel (I) zeigen teilweise eine hohe Selektivität und eignen sich deshalb zur Bekämpfung von unerwünschten Pflanzenwuchs in landwirtschaftlichen Kulturen.

Patentansprüche:

1. Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze,

worin

R¹ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z¹-R¹⁰,

R² und R³ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z²-R¹¹ oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen carbocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern oder einen heterocyclischen Rest mit 4 bis 10 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten zwei Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

R⁴ und R⁵ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 10 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen Acylrest oder

R⁴ und R⁵ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR⁴R⁵ einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 4

Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom die gegebenenfalls weiteren Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S ausgewählt sind und der Rest unsubstituiert oder substituiert ist,

- R⁶ Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen
 Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis
 10 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder
 Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3
 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf
 letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist, oder einen
 Acylrest,
- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Thiocyanato oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- R⁹ jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(C_1-C_6)Alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_6)Alkoxy$, (C_2-C_6) Alkenyloxy, (C_2-C_6) Alkinyloxy, (C_1-C_4) Alkylcarbonyl, (C_1-C_4) Alkyloxycarbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-thiocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylthiocarbonyl oder (C₁-C₄)Alkylthio-thiocarbonyl, wobei die Alkylreste in den letztgenannten 11 Resten unsubstituiert oder substituiert sind, oder (C1-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl, (C₁-C₄)Alkoxysulfonyl, Amino, Mono- oder Di- $\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-<math>\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-\{(C_1-C_6)alkyl\}amino, Mono- oder$ C_6)alkyl]aminocarbonyl, (C_1 - C_6)Alkanoylamino, N-(C_1 - C_6)Alkanoyl-N-(C_1 -C₄)alkyl-amino, oder einen Rest der Formel Z⁴-R⁰, wobei Z⁴ wie unten definiert und Ro einen aromatischen, gesättigten oder teilgesättigten carbocyclischen oder heterocyclischen Rest, wobei der cyclische Rest substituiert oder unsubstituiert ist, oder zwei benachbarte Reste R9 gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus

der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder einen heterocyclischen Rest, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder substituiert ist,
- eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR $^{\circ}$ oder -N(O)-, wobei q = 0, 1 oder 2 ist und R $^{\circ}$ Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S(O)_r-, -NR**- oder -N(O)-, wobei r=0, 1 oder 2 ist und R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel -0-, $-S(O)_p$ -, $-S(O)_p$ -O-, -O-S(O) $_p$ -, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -NR'-O-, -NR'-CO-, -CO-NR'- bedeutet und dabei p=0, 1 oder 2 ist und R' Wasserstoff, Alkyl mit 1 bis 6 C-Atomen, Phenyl, Benzyl, Cycloalkyl mit 3 bis 6 C-Atomen oder Alkanoyl mit 1 bis 6 C-Atomen ist,
- m 1, 2, 3 oder 4 und
- n 0, 1, 2, 3, 4 oder 5,

bedeuten.

- 2. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß
- R¹ H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder -Z¹-R¹⁰,
- ${
 m R^2}$ und ${
 m R^3}$ jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, ${
 m NO_2}$, CN, SCN oder einen Rest der Formel - ${
 m Z^2}$ - ${
 m R^{11}}$ oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 (C_3 - C_8)Cycloalkyl, (C_3 - C_8)Cycloalkenyl oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern und mit Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der letztgenannten 3 Reste unsubstituiert oder durch

einen oder mehrer Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

jeweils unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Alkylamino R⁴ und R⁵ oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 4 C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6 C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C1-C4)Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C2-C4)Alkenyloxy, (C2-C4)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $[(C_1-C_4)Alkoxy]$ -carbonyl, $[(C_1-C_4)Alkyl]$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di-[(C_1 - C_4)alkyl]-aminocarbonyl, (C_1 - C_4)Alkylsulfinyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfinyl, (C_1-C_4) Alkylsulfonyl, (C_1-C_4) Haloalkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch $(C_1-C_4)Alkyl$ und $(C_1-C_4)Haloalkyl$ substituiert ist.

oder einen Acylrest oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$ und Oxo substituiert ist,

R⁶ Wasserstoff, Amino, Alkylamino oder Dialkylamino mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen im Alkylrest, einen acyclischen oder cyclischen
Kohlenwasserstoffrest oder Kohlenwasserstoffoxyrest mit jeweils 1 bis 6
C-Atomen oder einen Heterocyclylrest, Heterocyclyloxyrest oder
Heterocyclylaminorest mit jeweils 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3
Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der fünf
letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste

aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Haloalk xy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_2-C_4) Alkenyl, (C_2-C_4) Alkinyl, (C_2-C_4) Alkenyloxy, (C_2-C_4) Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, $\{(C_1-C_4)$ Alkoxy $\}$ -carbonyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkyl $\}$ -carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di- $\{(C_1-C_4)$ Alkyl $\}$ -aminocarbonyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfinyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfinyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfonyl, $\{(C_1-C_4)$ Alkylsulfonyl und, im Falle cyclischer Reste, auch $\{(C_1-C_4)$ Alkylund $\{(C_1-C_4)$ Haloalkyl substituiert ist, oder einen Acylrest,

- R⁷ und R⁸ jeweils unabhängig voneinander H, Halogen, NO₂, CN, SCN oder einen Rest der Formel -Z³-R¹² oder
 R⁷ und R⁸ gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl und Oxo substituiert ist,
- jeweils unabhängig voneinander Halogen, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C₁-C₆)Alkyl, (C₁-C₆)Alkoxy, (C₁-C₄)Alkylcarbonyl, (C₁-C₄)Alkyloxycarbonyl oder (C₁-C₄)Alkylthiocarbonyl, wobei die letztgenannten fünf Reste unsubstituiert oder durch Halogen oder (C₁-C₄)Alkoxy substituiert sind, oder (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]amino, Aminocarbonyl, Mono- oder Di-[(C₁-C₄)alkyl]aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkanoylamino oder einen Rest der Formel Z⁴-R^o, worin Z⁴ wie unten definiert ist und R^o (C₃-C₆)Cycloalkyl, (C₃-C₆)Cycloalkenyl oder Phenyl bedeutet, wobei jeder der letztgenannten drei Reste unsubstituiert oder durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Haloalkyl und (C₁-C₄)Alkoxy substituiert ist, oder

zwei benachbarte Reste R^9 gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- R¹⁰, R¹¹, R¹² jeweils unabhängig voneinander H oder einen acyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 1 bis 6 C-Atomen, einem cyclischen Kohlenwasserstoffrest mit 3 bis 6 C-Atomen oder einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe N, O und S, wobei jeder der drei letztgenannten Reste unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C₁-C₄)Alkoxy, (C₁-C₄)Haloalkoxy, (C₁-C₄)Alkylthio, (C₂-C₄)Alkenyl, (C₂-C₄)Alkinyl, (C₂-C₄)Alkenyloxy, (C₂-C₄)Alkinyloxy, Hydroxy, Amino, Acylamino, Mono- und Dialkylamino, Nitro, Carboxy, Cyano, Azido, [(C₁-C₄)Alkoxy]-carbonyl, [(C₁-C₄)Alkyl]-carbonyl, Formyl, Carbamoyl, Mono- und Di-[(C₁-C₄)alkyl]-aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylsulfinyl, (C₁-C₄)Haloalkylsulfinyl, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, und, im Falle cyclischer Reste, auch (C₁-C₄)Alkyl und (C₁-C₄)Haloalkyl substituiert ist,
- x eine Gruppe der Formel -O-, -S(O) $_q$ -, -NR * oder -N(O)-, wobei q = 0, 1 oder 2 ist und R * Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR 13 R 14 , wobei die Definitionen für R 13 und R 14 aus den für R 2 und R 3 möglichen Resten ausgewählt sind,
- eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S(O)_r-, -NR**- oder -N(O)-, wobei r=0, 1 oder 2 ist und R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-,
- Z¹, Z², Z³, Z⁴ jeweils unabhängig voneinander eine direkte Bindung oder eine divalente Gruppe der Formel
 -O-, -S-, -CO-, -O-CO-, -CO-O-, -NR'-, -NR'-CO- oder -CO-NR'-, wobei R'
 H oder (C₁-C₄)Alkyl ist,

bedeuten.

- 3. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß
- R^1 , R^2 , R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(C_1-C_4)Alkyl$,

Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $((C_1-C_4)$ alkyl)amino, Halo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, Halo (C_1-C_4) alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylthio, Halo-(C₁-C₄)alkylthio, (C₂-C₆)Alkenyl, Halo-(C₂-C₆)Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4)alkyl, (C_3-C_9)Cycloalkylamino-(C_1-C_4$ (C₃-C₉)Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C1-C4) Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl (C_1-C_4)$ alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl, Phenoxy-(C₁-C₄)alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, $(C_1-C_4)Alkylthio, (C_1-C_4)Haloalkyl, (C_1-C_4)Haloalkoxy, Formyl,$ $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy,$ substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils mit 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O, S enthält,

- R² und R³ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR²R³ einen gesättigten oder teilweise ungesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern oder Heterocyclyl mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 3 Heteroringatomen aus der Gruppe O, N und S, wobei jeder der letztgenannten 2 cyclischen Reste unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Oxo substituiert ist,
- R^4 und R^5 unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl$, $Cyano-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]-amino$, $Halo-(C_1-C_4)alkyl$, $Hydroxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$,

 $Halo(C_1-C_4)alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_2-C_6)Alkenyl, Halo-(C_2-C_6)alkenyl,$ (C_2-C_6) Alkinyl, Halo- (C_2-C_6) alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, $\label{eq:continuous} \mbox{Di-[(C$_1$-C$_4)alkyl]-amino-(C$_1$-C$_4)alkyl, (C$_3$-C$_9)Cycloalkylamino-(C$_1$-C$_4)alkyl, (C$_3$-C$_9)Cycloalkylamino-(C$_1$-C$_9)alkyl, (C$_3$-C$_9)Cycloalkylamino-(C$_9$-C$_9)alkyl, (C$_9$-C$_$ (C3-C9)Cycloalkyl, (C3-C9)Heterocycl-(C1-C4)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkylamino-carbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C₁-C₄)Alkyl-carbonyl, (C₁-C₄)Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C₁-C₄)Alkyl, (C₁-C₄)Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy,$ substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N, O und S ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$ und Oxo substituiert ist,

 $\begin{array}{lll} \mathsf{R}^6 & \mathsf{Wasserstoff}, \, \mathsf{Amino}, \, \mathsf{Formyl}, \, (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkyl}, \, \mathsf{Cyano}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkylamino}, \, \mathsf{Di}\mathsf{-}[(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}]\mathsf{-}\mathsf{amino}, \, \mathsf{Halo}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & \mathsf{Hydroxy}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \, (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkoxy}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & \mathsf{Halo}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkoxy}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \, (\mathsf{C}_2\mathsf{-}\mathsf{C}_6)\mathsf{Alkenyl}, \, \mathsf{Halo}\mathsf{-}(\mathsf{C}_2\mathsf{-}\mathsf{C}_6)\mathsf{Alkinyl}, \, \mathsf{Halo}\mathsf{-}(\mathsf{C}_2\mathsf{-}\mathsf{C}_6)\mathsf{alkinyl}, \, (\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{Alkylamino}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ & \mathsf{Di}\mathsf{-}[(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}]\mathsf{-}\mathsf{amino}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \, (\mathsf{C}_3\mathsf{-}\mathsf{C}_9)\mathsf{Cycloalkylamino}\mathsf{-}(\mathsf{C}_1\mathsf{-}\mathsf{C}_4)\mathsf{alkyl}, \\ \end{array}$

 (C_3-C_9) Cycloalkyl, (C_3-C_9) Hetercycl- (C_1-C_4) alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C₁-C₄)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, $(C_1-C_4)Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4)Alkoxy,$ substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält,

R⁷ und R⁸ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, (C1-C4)Alkyl, Cyano- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $((C_1-C_4)$ alkyl)amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, Hydroxy- (C_1-C_4) alkyl, $\{C_1-C_4\}Alkoxy-\{C_1-C_4\}alkyl$, $Halo(C_1-C_4)alkoxy-\{C_1-C_4\}alkyl$, (C_1-C_4) Alkylthio, Halo- (C_1-C_4) alkylthio, (C_2-C_6) Alkenyl, $\label{eq:c2-C6-Alkinyl} \mbox{Halo-(C$_2$-C$_6)Alkinyl, Halo-(C$_2$-C$_6)alkinyl,}$ $(C_1-C_4) \\ Alkylamino-(C_1-C_4) \\ alkyl, \\ Di-\{(C_1-C_4) \\ alkyl\}-amino-(C_1-C_4) \\ alkyl, \\ Di-\{(C_1-C_4) \\ alkyl, \\$ (C_3-C_9) Cycloalkylamino- (C_1-C_4) alkyl, (C_3-C_9) Cycloalkyl, Heterocyclyl-(C₁-C₄)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe (C1-C4)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-carbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylamino-carbonyl-(C$

 (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, Aminocarbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio, oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylthio, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

 R^9 , wenn $\mathsf{n}=1$ ist, und die Reste R^9 , jeweils unabhängig voneinander, wenn n größer als 1 ist, Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Formyl, Carboxy, Cyano, Thiocyanato, $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{Alkyl}$, Cyano- $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{alkyl}$, $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{Alkoxy}$, $(\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{Alkylamino}$, Di-[($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4)\mathsf{alkyl}$]-amino, Halo-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, Hydroxy-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, ($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)Alkoxy-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, Halo-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, ($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)Alkylthio, Halo-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkylthio, ($\mathsf{C}_2\mathsf{-C}_6$)Alkenyl, Halo-($\mathsf{C}_2\mathsf{-C}_6$)Alkenyl, ($\mathsf{C}_2\mathsf{-C}_6$)Alkinyl, Halo-($\mathsf{C}_2\mathsf{-C}_6$)alkinyl, ($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)Alkylamino-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, Di-[($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl]-amino-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, ($\mathsf{C}_3\mathsf{-C}_9$)Cycloalkylamino-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl, ($\mathsf{C}_3\mathsf{-C}_9$)Cycloalkyl, Heterocyclyl-($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)alkyl mit 3 bis 9 Ringgliedern, wobei die cyclischen Gruppen in den letztgenannten 3 Resten unsubstituiert oder durch einen oder mehrere este aus der Gruppe ($\mathsf{C}_1\mathsf{-C}_4$)Alkyl, Halogen und Cyano substituiert sind, oder

Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl- (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl, (C_1-C_4) Alkyl-carbonyl, (C_1-C_4) Alkylamino-carbonyl, Phenoxy- (C_1-C_4) Alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) Alkyl, Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy,

Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 16 Reste, der im acyclischen Teil oder im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Nitro, Cyano, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkyl$ -carbonyl, $(C_1-C_4)Alkoxy$, substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten jeweils 3 bis 9 Ringatome oder 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N, O und S enthält, oder

zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist öder Heteroringatome aus der Gruppe O, S und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

- eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O-, -S- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Alkyl mit 1 bis 4 C-Atomen ist, oder eine Gruppe der Formel -CH₂-, -C(CH₃)H- oder -C(CH₃)₂-

bedeuten.

- 4. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß
- Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, Halo- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl, Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R^2 und R^3 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy, (C_1-C_4) Alkylamino, Di- $((C_1-C_4)$ Alkyl)-amino,

Halo- (C_1-C_4) alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, Phenyl oder Phenoxy oder einen Phenyl- oder Phenoxyrest, der im Phenylteil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^2 und R^3 gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe CR^2R^3 einen gesättigten carbocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringgliedern, der unsubstituiert oder mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe $(C_1-C_4)Alkyl$, Halogen und Oxo substituiert ist,

- R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Alkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino- (C_1-C_4) alkyl oder Phenyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl oder Phenoxy-carbonyl oder einen der letztgenannten drei Reste, der im Phenylteil bis zu dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder
 - R^4 und R^5 gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR^4R^5 einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weiter Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist und der Rest unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,
- Wasserstoff, Amino, Formyl, (C_1-C_4) Alkyl, Di- $[(C_1-C_4)$ alkyl]-amino, (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl, (C_2-C_6) Alkenyl, (C_2-C_6) Alkinyl, (C_1-C_4) Dialkylamino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl- (C_1-C_4) alkyl, Phenoxy-carbonyl, Phenylamino-carbonyl oder einen der letztgenannten fünf Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl, (C_1-C_4) Alkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist,
- R^7 und R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl$, $(C_2-C_6)Alkenyl$, $(C_2-C_6)Alkinyl$, $(C_1-C_4)alkyl$ -amino- $(C_1-C_4)alkyl$, Phenyl, Phenoxy- $(C_1-C_4)alkyl$,

Phenyl-(C_1 - C_4)alkyl oder einen der letztgenannt in drei Reste, der im Phenylteil einfach bis dreifach durch Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1 - C_4)Alkyl, (C_1 - C_4)Alkoxy und (C_1 - C_4)Alkoxy-carbonyl substituiert ist, oder

 R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen, die unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, (C_1-C_4) Alkyl und Oxo substituiert ist,

R⁹ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Amino, Nitro, Cyano, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylamino$, $Di-[(C_1-C_4)alkyl]$ amino, Perhalo-(C₁-C₄)alkyl, Hydroxy-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxy-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylthio, (C_2-C_6)Alkenyl,$ (C_2-C_6) Alkinyl, Di- (C_1-C_4) alkyl)-amino- (C_1-C_4) alkyl, Phenyl, Phenoxy, Phenylcarbonyl, Phenylcarbonyl-(C₁-C₄)alkyl, $(C_1-C_4)Alkoxycarbonyl-(C_1-C_4)alkyl, (C_1-C_4)Alkylcarbonyl,$ $(C_1-C_4)Alkyloxycarbonyl, Phenoxy-<math>(C_1-C_4)alkyl, Phenyl-(C_1-C_4)alkyl,$ Heterocyclyl, Heterocyclylamino, Heterocyclyloxy, Heterocyclylthio oder einen der letztgenannten 13 Reste, der im acyclischen Teil oder, vorzugsweise, im cyclischen Teil durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, $(C_1-C_4)Alkyl$, $(C_1-C_4)Alkoxy$, $(C_1-C_4)Alkylthio$, (C_1-C_4) Haloalkyl, (C_1-C_4) Haloalkoxy und (C_1-C_4) Alkoxy-carbonyl substituiert ist, wobei Heterocyclyl in den Resten 3 bis 6 Ringatome und 1 bis 3 Heteroringatome aus der Gruppe N und O aufweist, oder zwei benachbarte Reste R⁹ gemeinsam einen ankondensierten Cyclus mit 4 bis 6 Ringatomen, der carbocyclisch ist oder Heteroringatome aus der Gruppe O und N enthält und der unsubstituiert oder durch einen oder mehrere Reste (C1-C4)Alkyl substituiert ist,

eine Gruppe der Formel -O- oder -NR*-, wobei R* Wasserstoff oder Methyl ist, oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,

- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NR**-, wobei R** Wasserstoff oder Methyl ist, bedeuten.
- 5. Verbindungen der Formel (I) und deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß
- R¹ Wasserstoff, Halogen oder (C₁-C₄)Alkyl,
- ${
 m R}^2$ und ${
 m R}^3$ unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, (C $_1$ -C $_4$)Alkyl oder Phenyl oder

 ${
m R}^2$ und ${
m R}^3$ gemeinsam mit dem C-Atom der Gruppe ${
m CR}^2{
m R}^3$ gesättigtes $({
m C}_4{
m -}{
m C}_6)$ Cycloalkyl,

R⁴ und R⁵ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino, Formyl oder (C₁-C₄)Alkyl oder R⁴ und R⁵ gemeinsam mit dem Stickstoffatom der Gruppe NR⁴R⁵ einen heterocyclischen Rest mit 4 bis 6 Ringatomen und 1 bis 2 Heteroringatomen, wobei neben dem N-Atom das gegebenenfalls weitere Heteroringatom aus der Gruppe N und O ausgewählt ist,

R⁶ Wasserstoff oder (C₁-C₄)Alkyl,

 R^7 und R^8 unabhängig voneinander Wasserstoff, (C_1-C_4) Alkyl oder (C_1-C_4) Alkoxy- (C_1-C_4) alkyl oder R^7 und R^8 gemeinsam eine Alkylenkette mit 2 bis 4 C-Atomen,

 R^9 unabhängig voneinander Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, $(C_1-C_4)Alkyl$ oder $(C_1-C_4)Alkoxy$,

m 1 oder 2.

n 2 oder 3,

- x eine Gruppe der Formel -O- oder -NH- oder eine Gruppe der Formel CR¹³R¹⁴, wobei die Definitionen für R¹³ und R¹⁴ aus den für R² und R³ möglichen Resten ausgewählt sind,
- Y eine direkte Bindung oder eine Gruppe der Formel -O- oder -NHbedeuten.

- 6. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) oder der n Salzen nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man
- a) eine Verbindung der Formel (II),

$$R^{1} - C - \frac{X}{C} (CR^{2}R^{3})_{m} \qquad (II)$$

worin R¹⁵ eine funktionelle Gruppe aus der Gruppe Carbonsäureester, Carbonsäureorthoester, Carbonsäurechlorid, Carbonsäureamid, Carbonsäureanhydrid und Trichlormethyl bedeutet, mit einem Biguanidid der Formel (III) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt oder

b) eine Verbindung der Formel (IV),

$$\begin{array}{c|c}
R^{1} \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N \\
N & R^{16}
\end{array}$$
(IV)

worin R¹⁶ einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe bedeutet, mit einem geeigneten Amin der Formel (V) oder einem Säureadditionssalz hiervon

umsetzt oder

c) unter Reaktion einer austauschfähigen Gruppe am Triazin der Verbindungen der genannten Formel (IV) oder der Formel (X),

$$R^{1} - C \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m}$$

$$R^{16} \longrightarrow N \longrightarrow R^{16}$$

$$(X)$$

worin jeder der Reste R¹⁶ unabhängig voneinander einen austauschfähigen Rest oder eine Abgangsgruppe bedeutet, diese Verbindung mit einem geeigneten Aziridin der Formel (XI),

worin R⁷ und R⁸ wie in Formel (I) definiert sind, und nachfolgend mit einem geeigneten Nucleophil der Formel (XII)

unter Ringöffnung des Azirididinrings und, falls ein Triazin der Formel (X) eingesetzt wurde, durch Reaktion der noch vorhandenen austauschfähigen Gruppe am Triazingrundgerüst mit einer Verbindung der Formel NHR⁴R⁵ umsetzt oder

d) eine V rbindung der Formel (XIII)

durch Epoxidierung oder Cyclopropanierung in entsprechende Verbindungen der Formel (I) umsetzt,

wobei in den Formeln (II), (III), (IV), (V), (X), (XI), (XII) und (XIII) die Reste R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , R^9 sowie X, Y, m und n wie in Formel (I) definiert sind, mit der Maßgabe, daß in Variante d) m=1 ist.

- 7. Herbizides oder pflanzenwachstumsregulierende Mittel, dadurch gekennzeichnet, daß es mindestens eine Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 und im Pflanzenschutz übliche Formulierungshilfsmittel enthält.
- 8. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpflanzen oder zur Wachstumsregulierung von Pflanzen, dadurch gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge von mindestens einer Verbindung der Formel (I) oder deren Salz nach einem der Ansprüche 1 bis 5 auf die Schadpflanzen bzw. Pflanzen, deren Pflanzensamen oder die Fläche, auf der sie wachsen, appliziert.
- 9. Verwendung der Verbindungen der Formel (I) oder deren Salze nach einem der Ansprüche 1 bis 5 als Herbizide oder Pflanzenwachstumsregulatoren.

10. Verbindungen der Formel (IV),

$$\begin{array}{c}
R^{1} \xrightarrow{X} (CR^{2}R^{3})_{m} \\
N & N \\
R^{4}R^{5}N & N \\
\end{array}$$
(1V)

worin R^1 bis R^5 , X und m wie in Formel (I) nach einem der Ansprüche 1 bis 5 definiert sind und

 R^{16} (C₁-C₄)Alkylthio, (C₁-C₄)Alkylsulfonyl, Phenyl-(C₁-C₄)alkylthio, Phenyl-(C₁-C₄)alkylsulfonyl, (C₁-C₄)Alkylphenylthio oder (C₁-C₄)Alkylphenylsulfonyl bedeutet.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inter nat Application No PCT/EP 96/02479

A CLAS	STEICATION OF SURJECT MATERIAL	·	PCT/EP 96/02479
ÎPC 6	sification of subject matter C07D405/04 A01N43/68 C07D	251/18	
	to International Patent Classification (IPC) or to both national	classification and IPC	
	os searched		
IPC 6			
Document	ation searched other than minimum documentation to the exten	t that such documents are inclu	ided in the fields searched
Electronic	data hase consulted during the international search (name of da	ta base and, where practical, s	earch terms used)
C. DOCUN	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of	the relevant passages	Relevant to claim No.
A	EP,A,0 411 153 (IDEMITSU KOSAN LTD) 6 February 1991 cited in the application see claims	COMPANY	1,7
A	EP,A,0 509 544 (IDEMITSU KOSAN LTD) 21 October 1992 cited in the application see claims	COMPANY	1,7
Furt	her documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family men	mbers are listed in annex.
"A" docume conside "E" earlier of filing d "L" docume which is citation "O" docume other n "P" docume	ent which may throw doubts on priority claim(s) or is cited to establish the publication date of another n or other special reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or	or priority date and it cited to understand the invention "X" document of particular cannot be considered involve an inventive it document of particular cannot be considered document is combined.	hed after the international filing date tot in conflict with the application but the principle or theory underlying the spread of the claimed invention novel or cannot be considered to step when the document is taken alone or relevance; the claimed invention to involve an inventive step when the d with one or more other such docu- tion being obvious to a person skilled the same patent family
ate of the	actual completion of the international search		international search report
4	September 1996	12.0	19. 96
Vame and m	nailing address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax (+ 31-70) 340-3016	Authorized officer Van Bijle	en, H

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

.....formation on patent family members

Inter nal Application No PCT/EP 96/02479

			,	
Patent document cited in search report	Publication date	Patent memb		Publication date
EP-A-411153	06-02-91	AU-B- AU-B- CA-A,C EP-A- WO-A- JP-B- KR-B- LV-B- US-A- LT-A,B	628138 5082790 2027562 0620220 9009378 7112981 7039400 9401728 10864 5403815 5290754 640	10-09-92 05-09-90 21-08-90 19-10-94 23-08-90 02-05-95 01-05-95 05-03-94 20-06-96 04-04-95 01-03-94 27-12-94
EP-A-509544	21-10-92	JP-A- US-A-	5320145 5250686	03-12-93 05-10-93

Form PCT/ISA/2IS (petent family ennex) (July 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inter coales Aktenzeichen
PCT/EP 96/02479

A Prince	STETZTER LINE DES ANNO STETZTER	PL	1/EP 96/02479
ÎPK 6	sifizierung des Anmeldungsgegenstandes C07D405/04 A01N43/68 C07D25	51/18	
Nach der I	nternationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationale	n Klassifikation und der IPK	
B. RECH	ERCHIERTE GEBIETE		
Recherchie IPK 6	rter Mindestprüßtoff (Klassifikationssystem und Klassifikationss) CO7D A01N	mbole)	
Recherchie	rte aber nicht zum Mindestprüßtoff gehörende Veröffentlichunger	, soweit diese unter die recherchie	rten Gebiete fallen
			. •
Während d	er internstionalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank	(Name der Datenbank und evtl.	verwendete Suchbegriffe)
C. ALS W	ESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, zoweit erforderlich unter An	zabe der in Betracht kommenden 1	Ceile Bets Assessed No.
			Teile Betr. Anspruch Nr.
A	EP,A,0 411 153 (IDEMITSU KOSAN (LTD) 6.Februar 1991 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche	1,7	
A	EP,A,0 509 544 (IDEMITSU KOSAN (LTD) 21.Oktober 1992 in der Anmeldung erwähnt siehe Ansprüche	1,7	
entre	ere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu hmen	Siehe Anhang Patentian	vilie
'A" Veröffe aber ni 'E" älteren I	Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen : ntlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, cht als besonders bedeutsam anzuschen ist Ookument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen dedatum veröffentlicht worden ist	Anmeldung nicht kollidiert, a Erfindung zugrundeliegenden Theorie angegeben ist	nach dem internationalen Anmeldedatum röffentlicht worden ist und mit der sondern nur zum Verständnis des der Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden
L' Veroffa	ntlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft er- n zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer n im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden er die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie	erfinderischer Tätigkeit beruh "Y" Veröffentlichung von besonde	erer Bedeutung: die beansymichte Pefindung
Veröffer eine Be P Veröffer	int) ntlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, nutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht ntlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach anspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist	werden, wenn die Veröffentlie	chung mit einer oder mehreren anderen tegone in Verbindung gebracht wird und achmann naheliegend ist
Oaturo des A	September 1996	Absendedatum des internation 12, 09, 96	
lame und P	ostanschrift der Internationale Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2	Bevollmächtigter Bodiensteter	
	NL - 2280 HV Rijswijk Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+ 31-70) 340-3016	Van Bijlen, I	Н

1

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur seiben Patentfamilie gehören

Inter nales Aktenzeichen
PCT/EP 96/02479

				101/21 30/024/3	
Im Recherchenbericht geführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied Patenti		Datum der Veröffentlichung	
EP-A-411153	06-02-91	AU-B- AU-B-	628138	10-09-92	
		CA-A.C	5082790 2027562	05-09-90 21-08-90	
		EP-A-	0620220	19-10-94	
		WO-A-	9009378	23-08-90	
		JP-A-	7112981	02-05-95	
		JP-B- KR-B-	7039400	01-05-95	
		LV-B-	9401728 10864	05-03-94 20-06-96	
		US-A-	5403815	04-04-95	
		US-A-	5290754	01-03-94	
		LT-A,B	640	27-12-94	
EP-A-509544	21-10-92	JP-A-	5320145	03-12-93	
		US-A-	5250686	05-10-93	

			F P P
			4°(b) 2°
•			